

(19)日本国特許庁 (J P)

(12) 公 開 特 許 公 報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平10-287654

(43)公開日 平成10年(1998)10月27日

(51)Int.Cl. ⁶	識別記号	F I
C 0 7 D 231/18		C 0 7 D 231/18
A 0 1 N 43/56		A 0 1 N 43/56 F
C 0 7 D 231/20		C 0 7 D 231/20 Z
231/22		231/22 B
401/12	2 3 1	401/12 2 3 1
審査請求 未請求 請求項の数 5 O L (全 63 頁) 最終頁に続く		

(21)出願番号	特願平9-93593	(71)出願人	000003986 日産化学工業株式会社 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1
(22)出願日	平成9年(1997)4月11日	(72)発明者	近藤 康夫 千葉県船橋市坪井町722番地1日産化学工業株式会社中央研究所内
		(72)発明者	三ヶ島 巧 千葉県船橋市坪井町722番地1日産化学工業株式会社中央研究所内
		(72)発明者	佐藤 純 千葉県船橋市坪井町722番地1日産化学工業株式会社中央研究所内
		最終頁に続く	

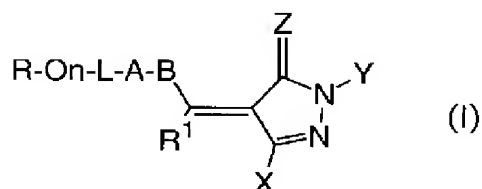
(54)【発明の名称】 ピラゾロン誘導体及び除草剤

(57)【要約】

【課題】新規除草剤の提供。

【解決手段】式(I)：

【化1】



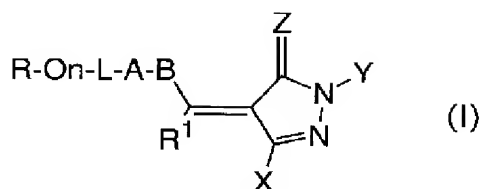
〔式中、Rは水素原子、Qaで置換されていてもよいフェニル基等を表し、Qaはハロゲン原子、C₁－C₄アルキル基等から選ばれる1以上の置換基を表し、R¹はC₁－C₆アルキル基、C₃－C₆シクロアルキル基、C₁－C₆ハロアルキル基等を表し、Xはシアノ基、C₁－C₄ハロアルキル基等を表し、Yは水素原子、C₁－C₆アルキル基等を表し、Zは酸素原子または硫黄原子を表し、Lは単結合、Qbによって置換されていてもよいC₁－C₆アルキレン等を表し、Qbはメチル基、メトキシカルボニル基等から選ばれる1以上の置換基を表し、nは0ま

たは1を表し、Aは単結合、C O等を表し、BはN R²、N R² N R³等を表し、R²およびR³は互いに独立して水素原子、メチル基等を表す。〕で表されるピラゾロン誘導体または農薬として許容されるその塩。

【特許請求の範囲】

【請求項1】式(I)：

【化1】



〔式中、Rは水素原子、Qaで置換されていてもよいフェニル基、Qaで置換されていてもよいピリジル基、Qaで置換されていてもよいフリル基、Qaで置換されていてもよいチエニル基、Qaで置換されていてもよいナフチル基またはQaで置換されていてもよい1, 2-ジオキシメチレンフェニル基を表し、

Qaはハロゲン原子、C₁-C₄アルキル基、フェニル基、C₁-C₄アルコキシ基、フェノキシ基、C₁-C₄ハロアルキル基、C₁-C₄ハロアルコキシ基、C₁-C₄アルキルチオ基、フェニルチオ基、C₁-C₄アルキルスルホニル基、C₁-C₄ハロアルキルチオ基、C₁-C₄アルキルアミノ基、ジ(C₁-C₄アルキル)アミノ基、C₁-C₄アルコキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、アミド基、C₁-C₄アルキルアミド基、フェニルアミド基、ジ(C₁-C₄アルキル)アミド基、ニトロ基、シアノ基、ヒドロキシ基、アセチルオキシ基およびベンゾイルオキシ基から選ばれる1以上の置換基を表し、

R¹はC₁-C₆アルキル基、C₃-C₆シクロアルキル基、C₁-C₆ハロアルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルアミノ基、C₁-C₆アルキルチオ基、シアノ基、Qaで置換されていてもよいフェニル基、Qaで置換されていてもよいベンジル基、Qaで置換されていてもよいスチリル基、Qaで置換されていてもよいシンナミル基、Qaで置換されていてもよいフェネチル基、Qaで置換されていてもよい3-フェニルノルマルプロピル基またはQaで置換されていてもよいベンジルチオ基を表し、

Xはシアノ基、ニトロ基、(C₁-C₄アルコキシ)カルボニル基、(C₁-C₄アルキル)カルボニルオキシ基、(C₁-C₄アルコキシ)カルボニルオキシ基、メタンスルホニルオキシ基、水酸基、エチニル基、アミド基、NR²R³、ハロゲン原子、C₁-C₄アルキル基、C₁-C₄ハロアルキル基またはQaで置換されていてもよいフェニル基を表し、

Yは水素原子、C₁-C₆アルキル基、C₃-C₆シクロアルキル基、C₁-C₆ハロアルキル基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、2-ヒドロキシエチル基、メトキシメチル基、アセチル基、メタンスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、Qaで置換されていてもよいフェニル基またはQaで置換されていてもよいベンジル基を表し、

Zは酸素原子または硫黄原子を表し、

Lは単結合、Qbによって置換されていてもよいC₁-C₆アルキレン、Qbによって置換されていてもよいC₂-C₆アルケニレンまたはQbによって置換されていてもよいC₂-C₄アルキニレンを表し、但し、R¹がC₁-C₃アルキル、XがC₁-C₃アルキル基またはC₁-C₃ハロアルキル基を表し、かつYがメチル基を表し、かつZが酸素原子を表すときはLは単結合、Qbによって置換されていてもよいC₂-C₆アルキレン、Qbによって置換されていてもよいC₂-C₆アルケニレンまたはQbによって置換されていてもよいC₂-C₄アルキニレンを表し、

Qbはメチル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、シアノ基およびフェニル基から選ばれる1以上の置換基を表し、

nは0または1を表し、

Aは単結合、CO、SO₂または酸素原子を表し、

Aが単結合を表すときはBはNR²またはNR²NR³を表し、AとLがともに単結合を表し、かつXがシアノ基を表すときはBは酸素原子または硫黄原子を表し、Aが単結合を表し、かつLがQbによって置換されていてもよいC₁-C₆アルキレン、Qbによって置換されていてもよいC₂-C₆アルケニレンまたはQbによって置換されていてもよいC₂-C₄アルキニレンを表すときはBは酸素原子または硫黄原子を表し、AがCOを表すときはBはNR²を表し、AがSO₂を表すときはBはNR²またはNR²NR³を表し、Aが酸素原子を表すときはBはNR₂を表し、

AとBは合一してNR²CONR³を構成していてもよく、

R²およびR³は互いに独立して水素原子、メチル基、ホルミル基、(C₁-C₄アルコキシ)カルボニル基、(C₁-C₄アルキル)カルボニル基、C₁-C₄アルキルスルホニル基およびフェニルスルホニル基から選ばれる置換基を表す。〕で表されるピラゾロン誘導体または農薬として許容されるその塩。

【請求項2】請求項1記載の化合物を有効成分として含む農薬。

【請求項3】請求項1記載の化合物を有効成分として含む除草剤。

【請求項4】Xがシアノ基を表す、請求項1記載の化合物。

【請求項5】〔R-On-L-A-Bが水酸基を表し、R¹がC₁-C₆アルキル基、C₃-C₆シクロアルキル基、C₁-C₆ハロアルキル基、Qaで置換されていてもよいベンジル基、Qaで置換されていてもよいスチリル基、Qaで置換されていてもよいシンナミル基、Qaで置換されていてもよいフェネチル基またはQaで置換されていてもよい3-フェニルノルマルプロピル基を表し、Xがシアノ基を表し、

Yが水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、 C_3-C_6 シクロアルキル基、 C_1-C_6 ハロアルキル基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、2-ヒドロキシエチル基、メトキシメチル基、アセチル基、メタンスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、Qaで置換されていてもよいフェニル基またはQaで置換されていてもよいベンジル基を表し、

Zが酸素原子または硫黄原子を表す。]で表される、請求項1記載の化合物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は新規なピラズロン誘導体および当該誘導体を有効成分として含有する農薬、特に除草剤に関するものである。

【0002】

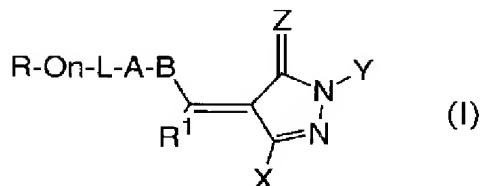
【従来の技術及び課題】ピラズロン誘導体に関しては、平成7年公開特許第316138号およびDE4130833に除草剤としての記載が、DE3728278に除草剤および殺菌剤としての記載がある。

【0003】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、新規なピラズロン誘導体について鋭意検討した結果、下記式で示される本発明化合物が優れた除草作用を有することを見出し、本発明を完成するに至った。即ち、本発明は式(1)：

【0004】

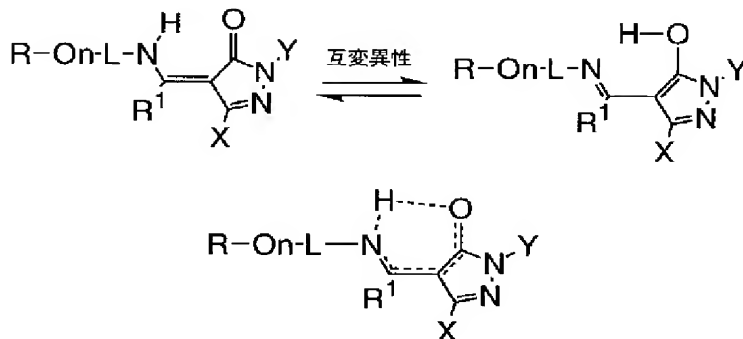
【化2】



【0005】〔式中、Rは水素原子、Qaで置換されていてもよいフェニル基、Qaで置換されていてもよいピリジル基、Qaで置換されていてもよいフリル基、Qaで置換されていてもよいチエニル基、Qaで置換されていてもよいナフチル基またはQaで置換されていてもよい1,2-ジオキシメチレンフェニル基を表し、Qaはハロゲン原子、 C_1-C_4 アルキル基、フェニル基、 C_1-C_4 アルコキシ基、フェノキシ基、 C_1-C_4 ハロアルキル基、 C_1-C_4 ハロアルコキシ基、 C_1-C_4 アルキルチオ基、フェニルチオ基、 C_1-C_4 アルキルスルホニル基、 C_1-C_4 ハロアルキルチオ基、 C_1-C_4 アルキルアミノ基、ジ(C_1-C_4 アルキル)アミノ基、 C_1-C_4 アルコキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基、アミド基、 C_1-C_4 アルキルアミド基、フェニルアミド基、ジ(C_1-C_4 アルキル)アミド基、ニトロ基、シアノ基、ヒドロキシ基、アセチルオキシ基およびベンゾイルオキシ基から選ばれる1以上の置換基を表し、 R^1 は C_1-C

$_6$ アルキル基、 C_3-C_6 シクロアルキル基、 C_1-C_6 ハロアルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルアミノ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、シアノ基、Qaで置換されていてもよいフェニル基、Qaで置換されていてもよいベンジル基、Qaで置換されていてもよいスチリル基、Qaで置換されていてもよいシンナミル基、Qaで置換されていてもよいフェネチル基、Qaで置換されていてもよい3-フェニルノルマルプロピル基またはQaで置換されていてもよいベンジルチオ基を表し、Xはシアノ基、ニトロ基、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル基、(C_1-C_4 アルキル)カルボニルオキシ基、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニルオキシ基、メタンスルホニルオキシ基、水酸基、エチニル基、アミド基、 NR^2 、 R^3 、ハロゲン原子、 C_1-C_4 アルキル基、 C_1-C_4 ハロアルキル基またはQaで置換されていてもよいフェニル基を表し、Yは水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、 C_3-C_6 シクロアルキル基、 C_1-C_6 ハロアルキル基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、ジメチルアミノカルボニル基、2-ヒドロキシエチル基、メトキシメチル基、アセチル基、メタンスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、Qaで置換されていてもよいフェニル基またはQaで置換されていてもよいベンジル基を表し、Zは酸素原子または硫黄原子を表し、Lは単結合、Qbによって置換されていてもよい C_1-C_6 アルキレン、Qbによって置換されていてもよい C_2-C_6 アルケニレンまたはQbによって置換されていてもよい C_2-C_4 アルキニレンを表し、但し、 R^1 が C_1-C_6 アルキル、Xが C_1-C_3 アルキル基または C_1-C_3 ハロアルキル基を表し、かつYがメチル基を表し、かつZが酸素原子を表すときはLは単結合、Qbによって置換されていてもよい C_2-C_6 アルキレン、Qbによって置換されていてもよい C_2-C_4 アルキニレンを表し、Qbはメチル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、シアノ基およびフェニル基から選ばれる1以上の置換基を表し、nは0または1を表し、Aは単結合、CO、 SO_2 または酸素原子を表し、Aが単結合を表すときはBは NR^2 または NR^2NR^3 を表し、AとLがともに単結合を表し、かつXがシアノ基を表すときはBは酸素原子または硫黄原子を表し、Aが単結合を表し、かつLがQbによって置換されていてもよい C_1-C_6 アルキレン、Qbによって置換されていてもよい C_2-C_6 アルケニレンまたはQbによって置換されていてもよい C_2-C_4 アルキニレンを表すときはBは酸素原子または硫黄原子を表し、AがCOを表すときはBは NR^2 を表し、Aが SO_2 を表すときはBは NR^2 または NR^2NR^3 を表し、Aが酸素原子を表すときはBは NR_2 を表し、AとBは合一して NR^2CONR^3 を構成していてもよく、 R^2 および R^3 は互いに独立して水素原子、メチル基、ホルミル基、(C_1-C_4 アルコキシ)カルボニル基、(C_1-C_4 アルキ

ル)カルボニル基、 C_1-C_4 アルキルスルホニル基およびフェニルスルホニル基から選ばれる置換基を表す。]で表されるピラズロン誘導体および農薬として許容されるその塩、そして、それを有効成分として含有する除草剤である。



スキーム1

【0008】また、本発明化合物に光学活性体、ジアステレオマー、幾何異性体が存在するときは、それぞれの混合物および分離されたそれぞれの異性体の双方を含む。

【0009】

【発明の実施の形態】式(1)中の具体的な置換基を列挙する。Rとしてはフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2,3-ジフルオロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、2,5-ジフルオロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、3,5-ジフルオロフェニル基、2,3-ジクロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、2,5-ジクロロフェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、2,3-ジブロモフェニル基、2,4-ジブロモフェニル基、2,5-ジブロモフェニル基、3,4-ジブロモフェニル基、3,5-ジブロモフェニル基、2,3,4-トリフルオロフェニル基、2,3,5-トリフルオロフェニル基、2,3,6-トリフルオロフェニル基、2,4,5-トリフルオロフェニル基、3,4,5-トリフルオロフェニル基、2,3,4-トリクロロフェニル基、2,3,5-トリクロロフェニル基、2,3,6-トリクロロフェニル基、2,4,5-トリクロロフェニル基、3,4,5-トリクロロフェニル基、2,3,4-トリブロモフェニル基、2,3,5-トリブロモフェニル基、2,3,6-トリブロモフェニル基、2,4,5-トリブロモフェニル基、3,4,5-トリブロモフェニル基、ペンタフルオロフェニル基、ペンタクロロフェニル基、3-クロロ-2-フルオロフェニル基、4-クロロ-2-フルオロフェニル基、5-クロロ-2-フルオロフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、3-クロロ-5-フルオロフェニル基、2-クロロ-5-フルオロフェニル基、3-クロロ-4-フルオロフェニル基、2-クロロ-4-フルオロフェニル基、2-クロロ-3-フルオロフェニル基、3-ブロモ-2-フルオロフェニル基、4-ブロモ-2-フル

【0006】なお、本発明化合物の中で、A-BがNHの場合、スキーム1に示すように両者の互変異性体を含むことを意味するか、分子内水素結合を意味する。

【0007】

【化3】

オロフェニル基、5-ブロモ-2-フルオロフェニル基、4-ブロモ-3-フルオロフェニル基、3-ブロモ-5-フルオロフェニル基、2-ブロモ-5-フルオロフェニル基、3-ブロモ-4-フルオロフェニル基、2-ブロモ-4-フルオロフェニル基、2-ブロモ-3-フルオロフェニル基、3-ブロモ-2-クロロフェニル基、4-ブロモ-2-クロロフェニル基、5-ブロモ-2-クロロフェニル基、4-ブロモ-3-クロロフェニル基、3-ブロモ-5-クロロフェニル基、2-ブロモ-5-クロロフェニル基、3-ブロモ-4-クロロフェニル基、2-ブロモ-4-クロロフェニル基、2-ブロモ-3-クロロフェニル基、3,4-ジクロロ-2-フルオロフェニル基、3,4-ジクロロ-5-フルオロフェニル基、3,4-ジクロロ-6-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2,3-ビストリフルオロメチルフェニル基、2,4-ビストリフルオロメチルフェニル基、2,5-ビストリフルオロメチルフェニル基、3,4-ビストリフルオロメチルフェニル基、3,5-ビストリフルオロメチルフェニル基、2-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェニル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェニル基、5-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-フルオロ-5-トリフルオロメチルフェニル基、2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル基、4-クロロ-3-トリフルオロメチルフェニル基、3-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメチルフェニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメチルフェニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル基、3-ブロモ-4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ブロモ-4-トリフルオロメチルフェニル基、2,3-ジフルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル基、3,4-ジフルオロ-5-トリフルオロメチルフェニル基、3,5-ジフルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル基、2,3,5,6-テトラフルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニ

ル基、2,3-ジメチルフェニル基、2,4-ジメチルフェニル基、2,5-ジメチルフェニル基、3,4-ジメチルフェニル基、3,5-ジメチルフェニル基、4-フルオロ-3-メチルフェニル基、2-フルオロ-4-メチルフェニル基、3-フルオロ-4-メチルフェニル基、4-クロロ-3-メチルフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、3-クロロ-4-メチルフェニル基、4-ブロモ-3-メチルフェニル基、2-ブロモ-4-メチルフェニル基、3-ブロモ-4-メチルフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2,3-ビス(トリフルオロメトキシ)フェニル基、2,4-ビス(トリフルオロメトキシ)フェニル基、2,5-ビス(トリフルオロメトキシ)フェニル基、3,4-ビス(トリフルオロメトキシ)フェニル基、3,5-ビス(トリフルオロメトキシ)フェニル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、2-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、4-クロロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ブロモ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-ブロモ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、4-クロロ-3-ニトロフェニル基、2,4-ジニトロフェニル基、3-メチル-4-ニトロフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、3,4-ジイソプロピルフェニル基、2-ピリジル基、4-フルオロ-2-ピリジル基、5-フルオロ-2-ピリジル基、6-フルオロ-2-ピリジル基、4-クロロ-2-ピリジル基、5-クロロ-2-ピリジル基、6-クロロ-2-ピリジル基、4-ブロモ-2-ピリジル基、5-ブロモ-2-ピリジル基、6-ブロモ-2-ピリジル基、3,5-ジフルオロ-2-ピリジル基、4,5-ジフルオロ-2-ピリジル基、5,6-ジフルオロ-2-ピリジル基、3,5-ジクロロ-2-ピリジル基、4,5-ジクロロ-2-ピリジル基、5,6-ジクロロ-2-ピリジル基、3,5-ジブロモ-2-ピリジル基、4,5-ジブロモ-2-ピリジル基、5,6-ジブロモ-2-ピリジル基、5-クロロ-3-フルオロ-2-ピリジル基、5-クロロ-4-フルオロ-2-ピリジル基、6-クロロ-5-フルオロ-2-ピリジル基、5-ブロモ-3-フルオロ-2-ピリジル基、5-ブロモ-4-フルオロ-2-ピリジル基、6-ブロモ-5-フルオロ-2-ピリジル基、3-クロロ-5-フルオロ-2-ピリジル基、4-クロロ-5-フルオロ-2-ピリジル基、5-クロロ-6-フルオロ-2-ピリジル基、5-ブロモ-3-クロロ-2-ピリジル基、5-ブロモ-4-クロロ-2-ピリジル基、6-ブロモ-5-クロロ-2-ピリジル基、5-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、3-フルオロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、4-フルオロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、6-フルオロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、

リフルオロメチル-2-ピリジル基、3-クロロ-5-トリフル
 オロメチル-2-ピリジル基、4-クロロ-5-トリフルオロメ
 チル-2-ピリジル基、6-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-
 -ピリジル基、3-ブロモ-5-トリフルオロメチル-2-ピリ
 ジル基、4-ブロモ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジル
 基、6-ブロモ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、3-
 ブロモ-5-フルオロ-2-ピリジル基、4-ブロモ-5-フル
 オロ-2-ピリジル基、5-ブロモ-6-フルオロ-2-ピリジル
 基、3-ブロモ-5-クロロ-2-ピリジル基、4-ブロモ-5-
 クロロ-2-ピリジル基、5-ブロモ-6-クロロ-2-ピリジル
 基、3-ピリジル基、5-フルオロ-3-ピリジル基、6-フル
 オロ-3-ピリジル基、5-クロロ-3-ピリジル基、6-クロロ
 -3-ピリジル基、5-ブロモ-3-ピリジル基、6-ブロモ-3-
 ピリジル基、2, 6-ジフルオロ-3-ピリジル基、4, 6-ジ
 フルオロ-3-ピリジル基、5, 6-ジフルオロ-3-ピリジル
 基、2, 6-ジクロロ-3-ピリジル基、4, 6-ジクロロ-3-
 ピリジル基、5, 6-ジクロロ-3-ピリジル基、2, 6-ジブ
 ロモ-3-ピリジル基、4, 6-ジブロモ-3-ピリジル基、5,
 6-ジブロモ-3-ピリジル基、6-クロロ-2-フルオロ-3-
 ピリジル基、6-クロロ-4-フルオロ-3-ピリジル基、6-
 クロロ-5-フルオロ-3-ピリジル基、6-ブロモ-2-フル
 オロ-3-ピリジル基、6-ブロモ-4-フルオロ-3-ピリジ
 ル基、6-ブロモ-5-フルオロ-3-ピリジル基、2-クロロ
 -6-フルオロ-3-ピリジル基、4-クロロ-6-フルオロ-3-
 ピリジル基、5-クロロ-6-フルオロ-3-ピリジル基、6-
 ブロモ-2-クロロ-3-ピリジル基、6-ブロモ-4-クロロ
 -3-ピリジル基、6-ブロモ-5-クロロ-3-ピリジル基、
 2-ブロモ-6-フルオロ-3-ピリジル基、4-ブロモ-6-
 フルオロ-3-ピリジル基、5-ブロモ-6-フルオロ-3-
 ピリジル基、2-ブロモ-6-クロロ-3-ピリジル基、4-
 ブロモ-6-クロロ-3-ピリジル基、5-ブロモ-6-クロロ
 -3-ピリジル基、6-トリフルオロメチル-3-ピリジル
 基、2-フルオロ-6-トリフルオロメチル-3-ピリジル
 基、4-フルオロ-6-トリフルオロメチル-3-ピリジル
 基、5-フルオロ-6-トリフルオロメチル-3-ピリジル
 基、2-クロロ-6-トリフルオロメチル-3-ピリジル基、
 4-クロロ-6-トリフルオロメチル-3-ピリジル基、5-
 クロロ-6-トリフルオロメチル-3-ピリジル基、2-ブ
 ロモ-6-メチル-3-ピリジル基、2-フルオロ-6-メチル
 -3-ピリジル基、4-フルオロ-6-メチル-3-ピリジル基、
 5-フルオロ-6-メチル-3-ピリジル基、2-クロロ-6-
 メチル-3-ピリジル基、4-クロロ-6-メチル-3-ピリジ
 ル基、5-クロロ-6-メチル-3-ピリジル基、2-ブロモ-
 6-メチル-3-ピリジル基、4-ブロモ-6-メチル-3-ピリ

ジル基、5-ブromo-6-メチル-3-ピリジル基、4-ピリジル基、2-フルオロ-4-ピリジル基、2-クロロ-4-ピリジル基、2-ブromo-4-ピリジル基、2-フリル基、4-フルオロ-2-フリル基、5-フルオロ-2-フリル基、4-クロロ-2-フリル基、5-クロロ-2-フリル基、4-ブromo-2-フリル基、5-ブromo-2-フリル基、4, 5-ジフルオロ-2-フリル基、4, 5-ジクロロ-2-フリル基、4, 5-ジブromo-2-フリル基、3-フリル基、5-フルオロ-3-フリル基、5-クロロ-3-フリル基、5-ブromo-3-フリル基、2-チエニル基、4-フルオロ-2-チエニル基、5-フルオロ-2-チエニル基、4-クロロ-2-チエニル基、5-クロロ-2-チエニル基、4-ブromo-2-チエニル基、5-ブromo-2-チエニル基、4, 5-ジフルオロ-2-チエニル基、4, 5-ジクロロ-2-チエニル基、4, 5-ジブromo-2-チエニル基、3-チエニル基、5-フルオロ-3-チエニル基、5-クロロ-3-チエニル基、5-ブromo-3-チエニル基、1-ナフチル基、3-フルオロ-1-ナフチル基、4-フルオロ-2-ナフチル基、3-クロロ-1-ナフチル基、4-クロロ-2-ナフチル基、3-ブromo-1-ナフチル基、4-ブromo-2-ナフチル基、2, 4-ジフルオロ-1-ナフチル基、3, 4-ジフルオロ-1-ナフチル基、2, 4-ジクロロ-1-ナフチル基、3, 4-ジブromo-1-ナフチル基、2, 4-ジブromo-1-ナフチル基、2-ナフチル基、4-フルオロ-2-ナフチル基、4-クロロ-2-ナフチル基、4-ブromo-2-ナフチル基、1, 2-ジオキシメチレン-3-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-4-フルオロ-3-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-5-フルオロ-3-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-6-フルオロ-3-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-4-クロロ-3-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-5-クロロ-3-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-6-クロロ-3-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-4-ブromo-3-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-5-ブromo-3-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-6-ブromo-3-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-4, 6-ジフルオロ-3-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-5, 6-ジフルオロ-3-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-4, 6-ジクロロ-3-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-5, 6-ジクロロ-3-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-4, 6-ジブromo-3-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-5, 6-ジブromo-3-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-4-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-6-フルオロ-4-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-6-クロロ-4-フェニル基、1, 2-ジオキシメチレン-6-ブromo-4-フェニル基および水素原子があげられる。

【0010】A-BとしてはNH、NMe、NCHO、NCOOMe、NCOOEt、NCOMe、NSO₂M

e、NSO₂Et、NSO₂Ph、CONH、CONMe、CONCHO、CONCOOMe、CONCOOEt、CONCOMe、CONSO₂Me、CONSO₂Et、CONSO₂Ph、NHNH、NHNMe、NHNCHO、NHNCOOMe、NHNCOOEt、NHNCOMe、NHNSO₂Me、NHNSO₂Et、NHN SO₂Ph、NMeNH、NMeNMe、NMeNCHO、NMeNCOOMe、NMeNCOOEt、NMeNCOMe、NMeNSO₂Me、NMeNSO₂Et、NMeNSO₂Ph、SO₂NH、SO₂NMe、SO₂NCHO、SO₂NCOOMe、SO₂NCOOEt、SO₂NCOMe、SO₂NSO₂Me、SO₂NSO₂Et、SO₂NSO₂Ph、SO₂NHNH、SO₂NHNMe、SO₂NHNCHO、SO₂NHNCOOMe、SO₂NHNCOOEt、SO₂NHNCOMe、SO₂NHNSO₂Me、SO₂NHNSO₂Et、SO₂NHNSO₂Ph、ONH、ONMe、ONCHO、ONCOOMe、ONCOOEt、ONCOMe、ONSO₂Me、ONSO₂Et、ONSO₂Ph、OおよびSがあげられる。

【0011】R1としてはメチル基、エチル基、ノルマルプロピル基、イソプロピル基、シクロプロピル基、ノルマルブチル基、イソブチル基、セカンダリーブチル基、シクロブチル基、ターシャリーブチル基、ノルマルペンチル基、シクロペンチル基、ノルマルヘキシル基、シクロヘキシル基、メチルチオ基、エチルチオ基、ベンジルチオ基、シアノ基、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブromoフェニル基、3-ブromoフェニル基、4-ブromoフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-メチルチオフェニル基、3-メチルチオフェニル基、4-メチルチオフェニル基、2-メタンスルホニルフェニル基、3-メタンスルホニルフェニル基、4-メタンスルホニルフェニル基、2-メチルアミノフェニル基、3-メチルアミノフェニル基、4-メチルアミノフェニル基、2-ジメチルアミノフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、2-メトキシカルボニルフェニル基、3-メトキシカルボニルフェニル基、4-メトキシカルボニルフェニル基、2-エトキシカルボニルフェニル基、3-エトキシカルボニルフェニル基、4-エトキシカルボニルフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ニトロフェニル基、4-ニトロフェニル基、2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、2, 4-ジク

クロフェニル基、2-クロロ-4-メタンスルホニルフェニル基、2-メタンスルホニル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-3-メトキシエトキシ-4-メタンスルホニルフェニル基、ベンジル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブromoベンジル基、3-ブromoベンジル基、4-ブromoベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-メチルチオベンジル基、3-メチルチオベンジル基、4-メチルチオベンジル基、2-メタンスルホニルベンジル基、3-メタンスルホニルベンジル基、4-メタンスルホニルベンジル基、2-メチルアミノベンジル基、3-メチルアミノベンジル基、4-メチルアミノベンジル基、2-ジメチルアミノベンジル基、3-ジメチルアミノベンジル基、4-ジメチルアミノベンジル基、2-メトキシカルボニルベンジル基、3-メトキシカルボニルベンジル基、4-メトキシカルボニルベンジル基、2-エトキシカルボニルベンジル基、3-エトキシカルボニルベンジル基、4-エトキシカルボニルベンジル基、2-ニトロベンジル基、3-ニトロベンジル基、4-ニトロベンジル基、2-シアノベンジル基、3-シアノベンジル基、4-シアノベンジル基、トリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロ-n-アロピル基、クロロジフルオロメチル基およびブromोजフルオロメチル基があげられる。

【0012】Xとしてはシアノ基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、アミド基、トリフルオロメチル基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、エチニル基、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-メチルチオフェニル基、3-メチルチオフェニル基、4-メチルチオフェニル基、2-メタンスルホンフェニル基、3-メタンスルホンフェニル基、4-メタンスルホンフェニル基、2-メチルアミノフェニル基、3-メチルアミノフェニル基、4-メチルアミノフェニル基、

フェニル基、2-ジメチルアミノフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、2-メトキシカルボニルフェニル基、3-メトキシカルボニルフェニル基、4-メトキシカルボニルフェニル基、2-エトキシカルボニルフェニル基、3-エトキシカルボニルフェニル基、4-エトキシカルボニルフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ニトロフェニル基、4-ニトロフェニル基、2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基および4-シアノフェニル基があげられる。

【0013】Yとしては水素原子、メチル基、エチル基、ノルマルプロピル基、イソプロピル基、シクロプロピル基、ノルマルブチル基、イソブチル基、セカンダリーブチル基、シクロブチル基、ターシャリーブチル基、ノルマルペンチル基、シクロペンチル基、ノルマルヘキシル基、シクロヘキシル基、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブromoフェニル基、3-ブromoフェニル基、4-ブromoフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-メチルチオフェニル基、3-メチルチオフェニル基、4-メチルチオフェニル基、2-メタンスルホニルフェニル基、3-メタンスルホニルフェニル基、4-メタンスルホニルフェニル基、2-メチルアミノフェニル基、3-メチルアミノフェニル基、4-メチルアミノフェニル基、2-ジメチルアミノフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、2-メトキシカルボニルフェニル基、3-メトキシカルボニルフェニル基、4-メトキシカルボニルフェニル基、2-エトキシカルボニルフェニル基、3-エトキシカルボニルフェニル基、4-エトキシカルボニルフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ニトロフェニル基、4-ニトロフェニル基、2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、ベンジル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブromoベンジル基、3-ブromoベンジル基、4-ブromoベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-メ

e) 雑草、イヌガラシ (Rorippa indica) 、ノハラガラシ (Sinapis arvensis) 、ナズナ (Capsella Bursapastoris) 等に代表されるアブラナ科 (Cruciferae) 雑草、イヌタデ (Polygonum Blumei) 、ソバカズラ (Polygonum convolvulus) 等に代表されるタデ科 (Polygonaceae) 雑草、スベリヒユ (Portulaca oleracea) 等に代表されるスベリヒユ科 (Portulacaceae) 雑草、シロザ (Chenopodium album) 、コアカザ (Chenopodium ficifolium) 、ホウキギ (Kochia scoparia) 等に代表されるアカザ科 (Cenopodiaceae) 雑草、ハコベ (Stellaria media) 等に代表されるナデシコ科 (Caryophyllaceae) 雑草、オオイヌフグリ (Veronica persica) 等に代表されるゴマノハグサ科 (Scrophulariaceae) 雑草、ツユクサ (Commelina communis) 等に代表されるツユクサ科 (Commelinaceae) 雑草、ホトケノザ (Lamium amplexicaule) 、ヒメオドリコソウ (Lamium purpureum) 等に代表されるシソ科 (Labiatae) 雑草、コニシキシソウ (Euphorbia supina) 、オオニシキシソウ (Euphorbia maculata) 等に代表されるトウダイグサ科 (Euphorbiaceae) 雑草、ヤエムグラ (Galium spurium) 、アカネ (Rubia akane) 等に代表されるアカネ科 (Rubiaceae) 雑草、 スミレ (Viola mandshurica) 等に代表されるスミレ科 (Violaceae) 雑草、アメリカツノクサネム (Sesbania exaltata) 、エビスグサ (Cassia obtusifolia) 等に代表されるマメ科 (Leguminosae) 雑草等の広葉雑草 (Broad-leaved weeds)、野生ソルガム (Sorghum bicolor) 、オオクサキビ (Panicum dichotomiflorum) 、ジョンソングラス (Sorghum halepense) 、イヌビエ (Echinochloa crus-galli var. crus-galli) 、ヒメイヌビエ (Echinochloa crus-galli var. praticola) 、栽培ビエ (Echinochloa utilis) 、メヒシバ (Digitaria adscendens) 、 カラスムギ (Avena fatua) 、オヒシバ (Eleusine indica) 、エノコログサ (Setaria viridis) 、スズメノテッポウ (Alopecurus aegualis) 等に代表されるイネ科雑草 (Gramineous weeds)、ハマスゲ (Cyperus rotundus, Cyperus esculentus) 等に代表されるカヤヅリグサ科雑草 (Cyperaceous weeds) 等の各種畑地雑草 (Cropland weeds) に低薬量で高い殺草力を有する。

【0017】又、水田用除草剤として湛水下の土壌処理及び茎葉処理のいずれの処理方法に於いても、ヘラオモダカ (Alisma canaliculatum) 、オモダカ (Sagittaria trifolia) 、ウリカワ (Sagittaria pygmaea) 等に代表されるオモダカ科 (Alismataceae) 雑草、タマガヤツリ (Cyperus difformis) 、ミズガヤツリ (Cyperus serotinus) 、ホタルイ (Scirpus juncoides) 、クログワイ (Eleocharis kuroguwai) 等に代表されるカヤヅリグサ科 (Cyperaceae) 雑草、アゼナ (Lindernia pyxidaria) 等に代表されるゴマノハグサ科 (Scrothulariaceae) 雑草、コナギ (Monochoria vaginalis) 等に代表されるミズアオイ科 (Potenderiaceae) 雑草、ヒルムシロ (Pot)

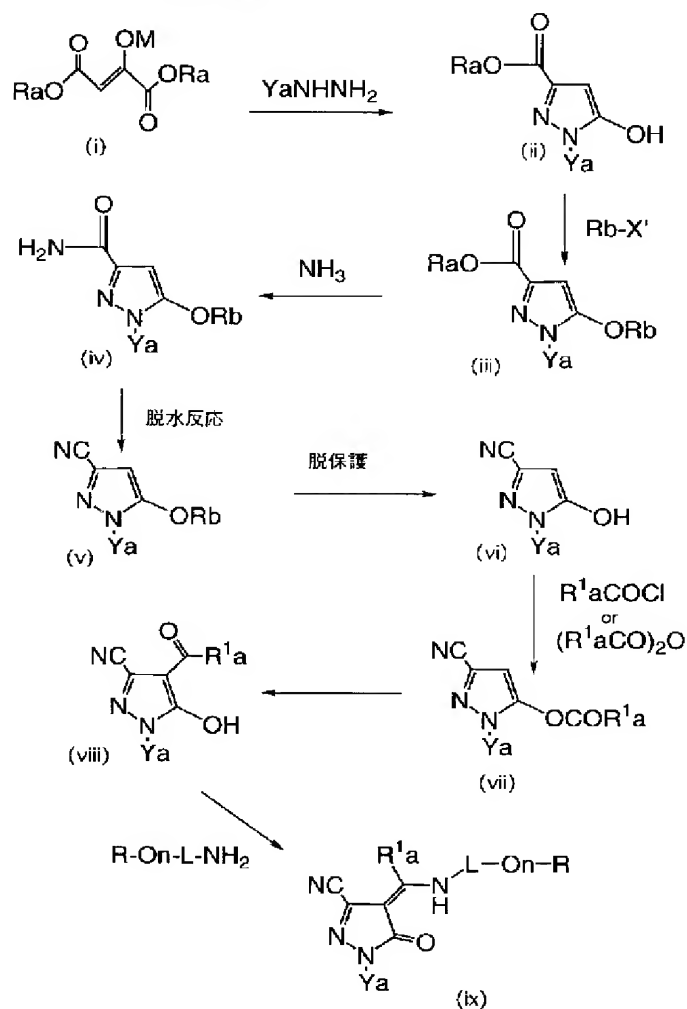
mogeton distinctus) 等に代表されるヒルムシロ科(Potamogetonaceae)雑草、キカシグサ (*Rotala indica*)等に代表されるミソハギ科(Lythraceae)雑草、タイヌビエ (*Echinochloa oryzicola*)、ヒメタイヌビエ (*Echinochloa crus-galli* var. *formosensis*)、イヌビエ (*Echinochloa crus-galli* var. *crus-galli*) 雑草等、各種、水田雑草 (Paddy weeds)に低薬量で高い殺草力を有する。

【0018】さらに本発明化合物のあるものは、重要作物であるイネ、コムギ、オオムギ、ソルゴー、落花生、トウモロコシ、大豆、棉、ビート等に対して高い安全性を有する。本発明化合物は、例えばスキーム2、3および4に示す方法によって合成することができる。スキーム2、3および4のRaはC₁–C₄アルキル基を表し、Rbはメトキシメチル基、メトキシエトキシメチル基等の保護基 (たとえばProtective Group in Organic Synthesis Second Edition P14–87に記載されてい

るものに準ずる)を表し、X' はハロゲン原子等の脱離基を表し、Yaは水素原子、C₁–C₆アルキル基、C₃–C₆シクロアルキル基、またはQaで置換されてもよいPh基、Qaで置換されてもよいベンジル基 (Qa前記と同様の意味を表す。)を表し、R1aはC₁–C₆アルキル基、C₃–C₆シクロアルキル基、C₁–C₆ハロアルキル基、またはQaで置換されてもよいPh基、Qaで置換されてもよいベンジル基、Qaで置換されてもよいフェネチル基、Qaで置換されてもよいスチリル基、Qaで置換されてもよいフェニルプロピル基を表し、Mは水素原子、ナトリウム等のアルカリ金属を表し、XaはC₁–C₄アルキル基、C₁–C₄ハロアルキル基またはQaで置換されてもよいフェニル基を表し、Wはジメチルアミノ基またはORaを表し、R、On、L、XおよびYは前記と同様の意味を表す。

【0019】

【化4】



【0020】スキーム2に示すように、本発明化合物の中間体となる3-シアノ-5-ヒドロキシピラゾール誘導

体(vi)は、オキサロ酢酸ジエステル類(i)にヒドラジン類を反応させて3-アルコキシカルボニル-5-ヒド

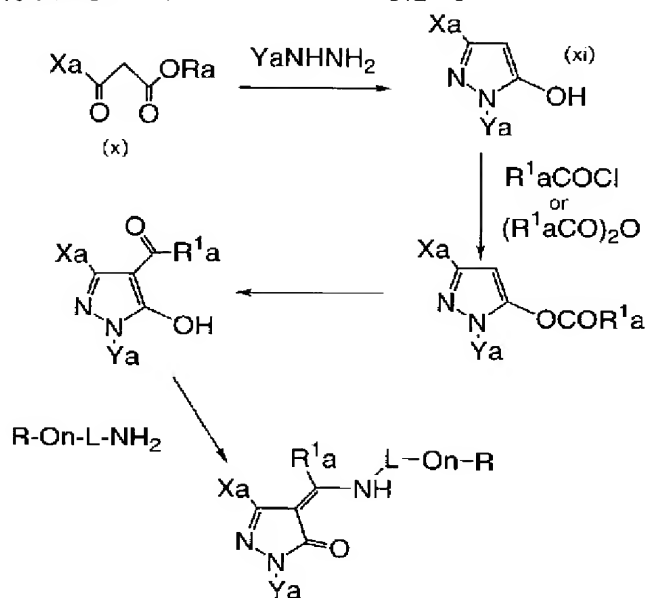
ロキシピラゾール誘導体(ii)とし、次いでヒドロキシ基を保護した後にアミド化反応を経て脱水反応を行い、脱保護反応を経て合成することができる。その際に用いる好ましい脱水剤としては、例えばトリクロロアセチルクロライド、トリフルオロアセチックアンハイドライド、クロロスルホニルイソシアネート、パラトルエンスルホニルクロライド、トリメチルシリルクロライド等の他、新実験化学講座第4版第14巻P1470-1473に記載されているものがあげられる。

【0021】このようにして得られた3-シアノ-5-ヒ

ドロキシピラゾール誘導体(vi)をカルボニルクロラド類又は、カルボン酸無水物類と反応させ(vii)とし、次いで(viii)とした後、アミン類と反応させることにより本発明化合物を製造することができる。また、スキーム3に示すように、本発明化合物の中間体となる5-ヒドロキシピラゾール誘導体(xi)は、ペーターケトエステル誘導体(x)にヒドラジン類を反応させて合成し、以下前記と同様の方法にて本発明化合物に至る。

【0022】

【化5】



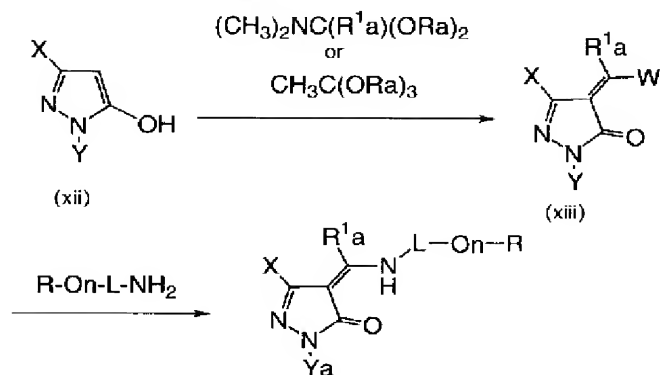
スキーム3

【0023】さらに本発明化合物は、スキーム4に示すように、5-ヒドロキシピラゾール誘導体(xii)にオルト酢酸エステル類を反応させるか、N, N-ジメチルアセトアミドジアルキルアセタール類を反応させることにより4-(1-エチリデン)ピラズリン-5-オン誘導体

(xiii)を合成した後、以下前記同様の方法にて本発明化合物に至る。

【0024】

【化6】



スキーム4

【0025】以下に本発明化合物およびその中間体の合成例を実施例として具体的に述べるが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

【0026】

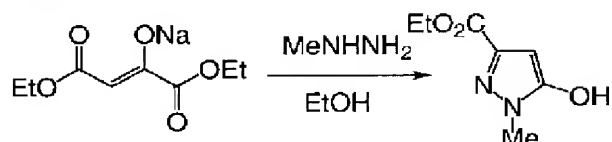
【実施例】

【実施例1】

3-エトキシカルボニル-5-ヒドロキシ-1-メチルピラゾールの合成

【0027】

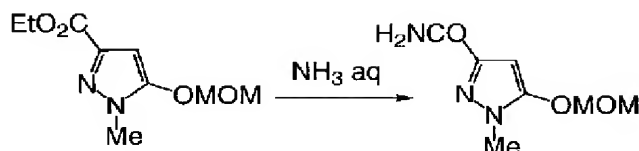
【化7】



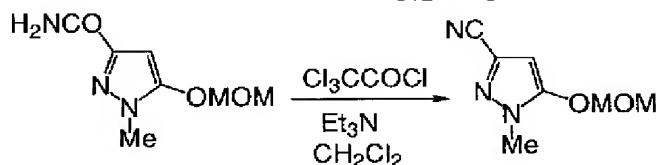
【0028】オキサル酢酸ジエチルナトリウム 50gを50mlのエタノールに懸濁させ、室温で酢酸25mlを加えたのち、メチルヒドラジン15gを30分かけて滴下した。その後室温で2.5時間攪拌し、次いで4.5時間加熱還流した。冷却後、溶媒を減圧留去し水を加え酢酸エチルで抽出し、有機層を水で洗浄した。その後有機層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、ろ過し溶媒を減圧留去した。残渣に水を加えて析出する結晶を減圧ろ過し、水で洗浄することにより3-エトキシカルボニル-5-ヒドロキシ-1-メチルピラゾール23gを固体として得た。

【実施例2】

3-エトキシカルボニル-5-メトキシメトキシ-1-メチルピラゾールの合成



【0032】3-エトキシカルボニル-5-メトキシメトキシ-1-メチルピラゾール62.3gに、28%アンモニア水400mlを加え室温で一晩攪拌した。溶媒を完全に減圧留去した後、残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄し3-アミド-5-メトキシメトキシ-1-メチルピラゾール51.33gを固体で得た。



【0034】3-アミド-5-メトキシメトキシ-1-メチルピラゾール30gを塩化メチレン200mlに溶解し、トリエチルアミン50mlを加えた。氷冷下、トリクロロアセチルクロライド32.4gをゆっくり滴下し室温で6時間攪拌した。溶媒を減圧留去した後、残渣をジエチルエーテルで抽出し、溶媒を減圧留去した。カラムクロマトグラフィーで粗精製し29gの3-シアノ-5-メトキシメトキシ-1-メチルピラゾールを液体で得た。

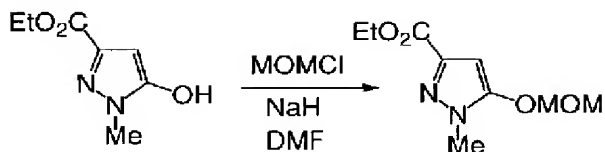
【0035】 $n_D^{21.4}$ 1.4886

【実施例5】

3-シアノ-5-ヒドロキシ-1-メチルピラゾールの合

【0029】

【化8】



【0030】3-エトキシカルボニル-5-ヒドロキシ-1-メチルピラゾール60gを300mlのジメチルホルムアミドに溶かし、氷冷下で水素化ナトリウム14g (60%in oil)を徐々に加え5分間攪拌した後に、メトキシメチルクロライド29gを滴下し室温で一晩攪拌した。反応混合物を氷水にあげ、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、溶媒を留去し、残渣をヘキサンで洗浄することにより3-エトキシカルボニル-5-メトキシメトキシ-1-メチルピラゾール62.3gを固体として得た。

【実施例3】

3-アミド-5-メトキシメトキシ-1-メチルピラゾールの合成

【0031】

【化9】

融点 108-110℃

【実施例4】

3-シアノ-5-メトキシメトキシ-1-メチルピラゾールの合成

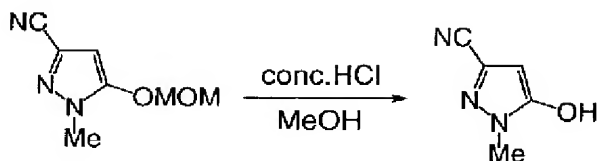
【0033】

【化10】

成

【0036】

【化11】



【0037】3-シアノ-5-メトキシメトキシ-1-メチルピラゾール16gをメタノール100mlに溶かし、濃塩

酸1.5mlを滴下後2時間加熱還流した。冷却後、溶媒を減圧留去し、残渣をクロロホルムで洗浄し3-シアノ-5-ヒドロキシ-1-メチルピラゾール8.36gを固体で得た。

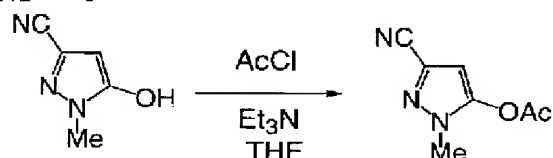
融点 182-184℃

【実施例6】

5-アセチルオキシ-3-シアノ-1-メチルピラゾールの合成

【0038】

【化12】

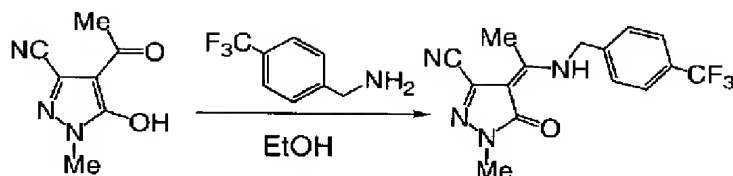


【0039】3-シアノ-5-ヒドロキシ-1-メチルピラゾール22.4 gを250 mlの乾燥テトラヒドロフランに懸濁させ、室温にてアセチルクロリド13.5mlを加えた後、氷冷下トリエチルアミン28mlを加えた。その後氷冷下、45分攪拌した。溶媒を減圧留去した後、水を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を水、及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後濾過した後、溶媒を減圧留去することにより5-アセチルオキシ-3-シアノ-1-メチルピラゾール29gを得た。

【0040】 $n_D^{20.9} 1.4622$

【実施例7】

4-アセチル-3-シアノ-5-ヒドロキシ-1-メチルピラゾールの合成



【0044】4-アセチル-3-シアノ-5-ヒドロキシ-1-メチルピラゾール5gをエタノール100mlに懸濁させ室温にて4-トリフルオロメチルベンジルアミン4.3mlを加え1時間加熱還流した。冷却後、溶媒を減圧留去し残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製した。その後n-ヘキサンを加え、析出した結晶を減圧濾過しノルマルヘキサンで洗浄することにより、3-シアノ-1-メチル-4-[1-(4-トリフルオロメチルベンジルアミノ)エチリデン]ピラズリン-5-オン7 gを固体として得た。

【実施例9】

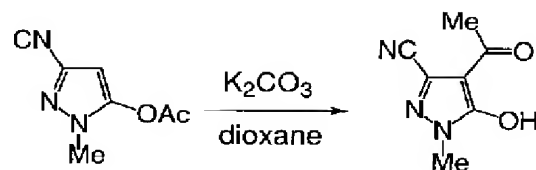
5-ヒドロキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾールの合成

【0045】

【化15】

【0041】

【化13】



【0042】5-アセチルオキシ-3-シアノ-1-メチルピラゾール11.3gを乾燥1,4-ジオキサンに溶かし、室温にて炭酸カリウム9.5gを加え2時間加熱還流した。冷却後、水を加えクロロホルムで洗浄した。水層が酸性になるまで塩酸を加え、生成した油状物をクロロホルムで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後濾過し、溶媒を減圧留去した。残渣にエタノールを加え析出した結晶を減圧濾過し、エタノールで洗浄する事により、4-アセチル-3-シアノ-5-ヒドロキシ-1-メチルピラゾール6gを固体として得た。

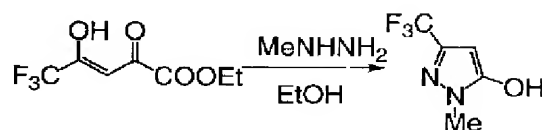
融点 147-149℃

【実施例8】

3-シアノ-1-メチル-4-[1-(4-トリフルオロメチルベンジルアミノ)エチリデン]ピラズリン-5-オン(化合物No. 3)の合成

【0043】

【化14】



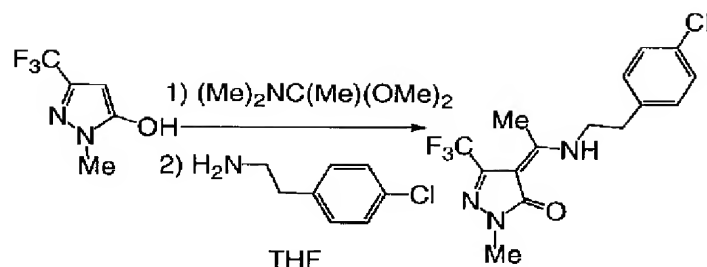
【0046】エチル トリフルオロメチルアセトアセテート200gをエタノール100mlに溶解し、0℃にてメチルヒドラジン54gを20分かけて滴下し、14時間加熱還流後した。冷却後、溶媒を減圧留去し、得られた結晶を減圧濾過により濾取してクロロホルムで洗浄することにより、5-ヒドロキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール91gを固体として得た。

【実施例10】

1-メチル-3-トリフルオロメチル-4-[1-(4-クロロフェネチルアミノ)エチリデン]ピラズリン-5-オン(化合物No. 28)の合成

【0047】

【化16】



【 0 0 4 8 】 5-ヒドロキシ-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール 2 g を乾燥テトラヒドロフラン 10 m l に溶かし、ジメチルアセトアミドジメチルアセター 1.5 g を滴下した後、室温で一晩攪拌した。さらに、4-クロロフェネチルアミン 1.9 g を加え、一晩攪拌し溶媒を減圧留去した。そのまま、カラムクロマトグラフィー（展開溶媒：クロロホルム）により精製し、0.18 g の 1-メチル-3-トリフルオロメチル-4-[1-(4-クロロフェネチルアミノ)エチリデン]ピラゾリン-5-オンを固体で得た。

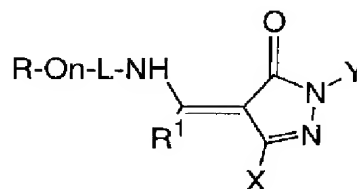
【 0 0 4 9 】 前記実施例に準じて合成した本発明化合物の構造式と物性値を前記実施例を含めそれぞれ表-1、

表-2、表-3 および表-4 に示す。

〔表-1〕

【 0 0 5 0 】

【 化 1 7 】



【 0 0 5 1 】

【 表 1 】

化合物	R	On-L	R ¹	X	Y
1	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	Me	CN	Ph
2	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	Me	Ph	Ph
3	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	Me	CN	Me
4	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	Me	COOEt	Me
5	4-Cl-Ph	(CH ₂) ₂	Me	COOEt	Me
6	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	Me	Br	Ph
7	4-Cl-Ph	(CH ₂) ₂	Me	Br	Ph
8	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	Me	CONH ₂	Me
9	3,4-Cl ₂ -Ph	(CH ₂) ₂	Me	CN	Me
10	3,4-Cl ₂ -Ph	CH ₂	Me	CN	Me
11	2,4-Cl ₂ -Ph	(CH ₂) ₂	Me	CN	Me
12	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	Et	CN	Me
13	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	Me	Ph	Me
14	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	Me	4-F-Ph	Me
15	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	Me
16	H	CH ₂	Me	4-F-Ph	Me
17	H	(CH ₂) ₅	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	Me
18	3,4-Cl ₂ -Ph	CH ₂	i-Pr	CN	Me
19	3,4-Cl ₂ -Ph	CH ₂	Et	CN	Me
20	Ph	-	Me	CF ₃	Me
21	4-CF ₃ -Ph	-	Me	CF ₃	Me
22	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	Me	CF ₃	Et
23	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	Me	CF ₃	Ph

【 0 0 5 2 】

【 表 2 】

化合物	R	On-L	R ¹	X	Y
-----	---	------	----------------	---	---

24	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	Me	CF ₃	i-Pr
25	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	Me	CF ₃	n-Bu
26	2-Cl-Ph	(CH ₂) ₂	Me	CF ₃	Me
27	3-Cl-Ph	(CH ₂) ₂	Me	CF ₃	Me
28	4-Cl-Ph	(CH ₂) ₂	Me	CF ₃	Me
29	Ph	(CH ₂) ₃	Me	CF ₃	Me
30	H	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂	Me	CF ₃	Me
31	4-ヒリジル	CH ₂	Me	CF ₃	Me
32	3-Cl-Ph	NH	Me	CF ₃	Me
33	Ph	CH=CHCH ₂	Me	CF ₃	Me
34	4-F-Ph	(CH ₂) ₂	Me	CF ₃	Me
35	4-Cl-Ph	CH ₂ CH(Me)	Me	CF ₃	Me
36	3, 4-Cl ₂ -Ph	(CH ₂) ₂	Me	CF ₃	Me
37	Ph	(CH ₂) ₄	Me	CF ₃	Me
38	H	(CH ₂) ₇	Me	CF ₃	Me
39	4-Me-Ph	(CH ₂) ₂	Me	CF ₃	Me
40	4-MeO-Ph	(CH ₂) ₂	Me	CF ₃	Me
41	2, 4-Cl ₂ -Ph	(CH ₂) ₂	Me	CF ₃	Me
42	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	Me	CF ₃	CH ₂ Ph
43	3, 4-Cl ₂ -Ph	(CH ₂) ₂	Me	CF ₃	CH ₂ Ph
44	Ph	CH ₂ O	Me	CF ₃	Me
45	H	(CH ₂) ₇	Me	CF ₃	CH ₂ Ph
46	EtO	(CH ₂) ₂	Me	CF ₃	CH ₂ Ph

【 0 0 5 3 】

【 表 3 】

化合物	R	On-L	R ¹	X	Y
47	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	Me	CF ₃	t-Bu
48	3, 4-Cl ₂ -Ph	(CH ₂) ₂	Me	CF ₃	t-Bu
49	Ph	(CH ₂) ₂	Me	CF ₃	Me
50	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	PhCH ₂	CF ₃	Me
51	4-Cl-Ph	(CH ₂) ₂	Me	CF ₃ CF ₂	Me
52	2-チエニル	CH ₂	Me	CF ₃	Me
53	2-フリル	CH ₂	Me	CF ₃	Me
54	4-Cl-Ph	(CH ₂) ₂	PhCH ₂	CF ₃	Me
55	H	CH ₂	PhCH ₂	CF ₃	Me
56	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	4-Cl-PhCH ₂	CF ₃	Me
57	H	CH ₂	4-Cl-PhCH ₂	CF ₃	Me
58	1,2-ジオキシメチレン -4-Ph	CH ₂	Me	CF ₃	Me
59	4-NO ₂ -Ph	CH ₂	Me	CF ₃	Me
60	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	Me	t-Bu	Me
61	3, 4-Cl ₂ -Ph	(CH ₂) ₂	Me	c-Pr	Me
62	3, 4-Cl ₂ -Ph	(CH ₂) ₂	Et	CN	Me
63	3, 4-Cl ₂ -Ph	(CH ₂) ₂	i-Pr	CN	Me
64	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	i-Pr	CN	Me
65	3, 4-Cl ₂ -Ph	CH ₂	n-Pr	CN	Me
66	3, 4-Cl ₂ -Ph	CH ₂	c-Pr	CN	Me

67	4-CF ₃ -Ph	CH ₂	c-Pr	CN	Me
68	3,4-Cl ₂ -Ph	(CH ₂) ₂	c-Pr	CN	Me

〔表-2〕
【0054】

【表4】

化合物NO.	物理的性質
1	mp 157-161℃
2	mp 149-152℃
3	mp 115-117℃
4	mp 130-132℃
5	n _D ^{20.3} 1.4661
6	mp 164-166℃
7	mp 143-145℃
8	mp 174-176℃
9	mp 140-142℃
10	mp 153-155℃
11	mp 184-186℃
12	mp 93-95℃
13	mp 169-171℃
14	mp 182-184℃
15	mp 163-165℃
16	mp 152-154℃
17	mp 83-85℃
18	mp 47-49℃
19	mp 146-148℃
20	mp 108-110℃
21	mp 142-144℃
22	n _D ^{20.4} 1.5176

【0055】

【表5】

化合物NO.	物理的性質
23	mp 145-147℃
24	mp 107-110℃
25	mp 92-95℃
26	mp 96-100℃
27	n _D ^{20.5} 1.5571
28	mp 148-153℃
29	n _D ^{20.5} 1.5500
30	n _D ^{20.5} 1.4401
31	mp 131-133℃
32	mp 176-178℃
33	n _D ^{20.3} 1.4211
34	mp 157-159℃
35	n _D ^{20.3} 1.4447
36	mp 151-153℃
37	mp 34-36℃

38	$n_D^{19.8}$ 1.4998
39	mp 104-106°C
40	mp 54-56°C
41	mp 155-157°C
42	mp 93-95°C
43	mp 97-99°C
44	mp 125-126°C
45	$n_D^{20.0}$ 1.4836

【0056】

【表6】

化合物NO.	物理的性質
46	mp 49-51°C
47	mp 102-104°C
48	mp 78-80°C
49	mp 81-82°C
50	mp 90-91°C
51	mp 55-57°C
52	mp 107-109°C
53	mp 78-80°C
54	mp 99-101°C
55	mp 115-118°C
56	$n_D^{21.4}$ 1.5464
57	mp 163-165°C
58	mp 149-151°C
59	mp 176-178°C
60	mp 131-133°C
61	mp 135-137°C
62	mp 129-131°C
63	mp 111-113°C
64	mp 33-35°C
65	mp 119-121°C
66	mp 139-141°C
67	mp 82-84°C
68	mp 126-128°C

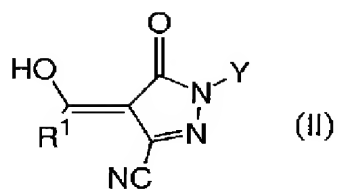
〔表-3〕

【0057】

【化18】

【0058】

【表7】



化合物No.	R ¹	Y
(II)-1	Me	Me

(II)-2	Et	Me
(II)-3	i-Pr	Me
(II)-4	n-Pr	Me
(II)-5	c-Pr	Me
(II)-6	4-Cl-PhCH=CH	Me

〔表-4〕
【0059】

【表8】

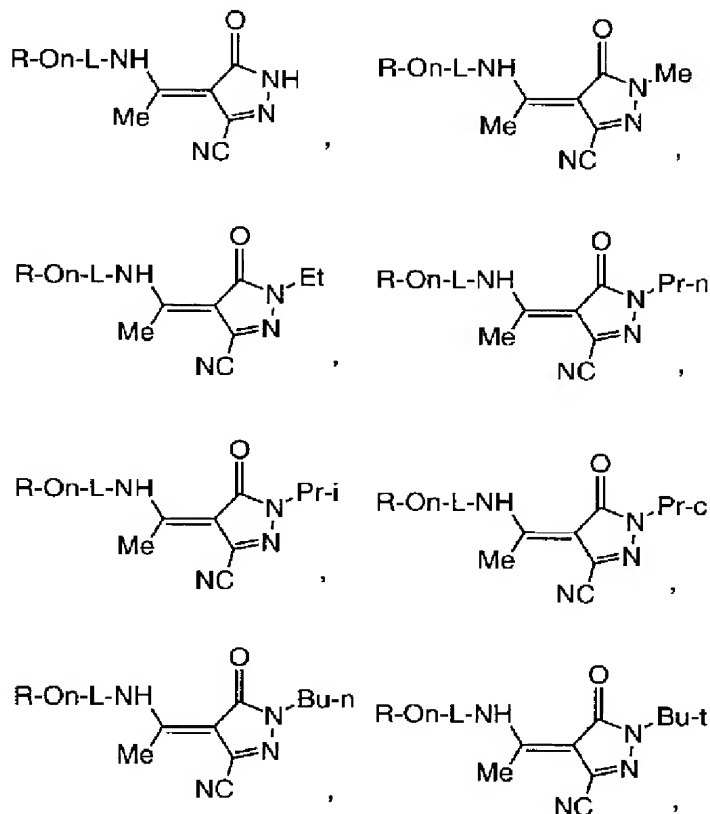
化合物No.	物理的性質
(II)-1	mp 147-149℃
(II)-2	mp 126-128℃
(II)-3	mp 77-79℃
(II)-4	mp 90-92℃
(II)-5	mp 123-125℃
(II)-6	mp 187-189℃

但し表中、Meはメチル基を、Etはエチル基を、i-Prはイソプロピル基を、c-Prはシクロプロピル基を、n-Prはノルマルプロピル基を、Phはフェニル基を表す。

【0060】前記スキームあるいは実施例に準じて合成される本発明化合物を前記実施例を含め表-5、表-6

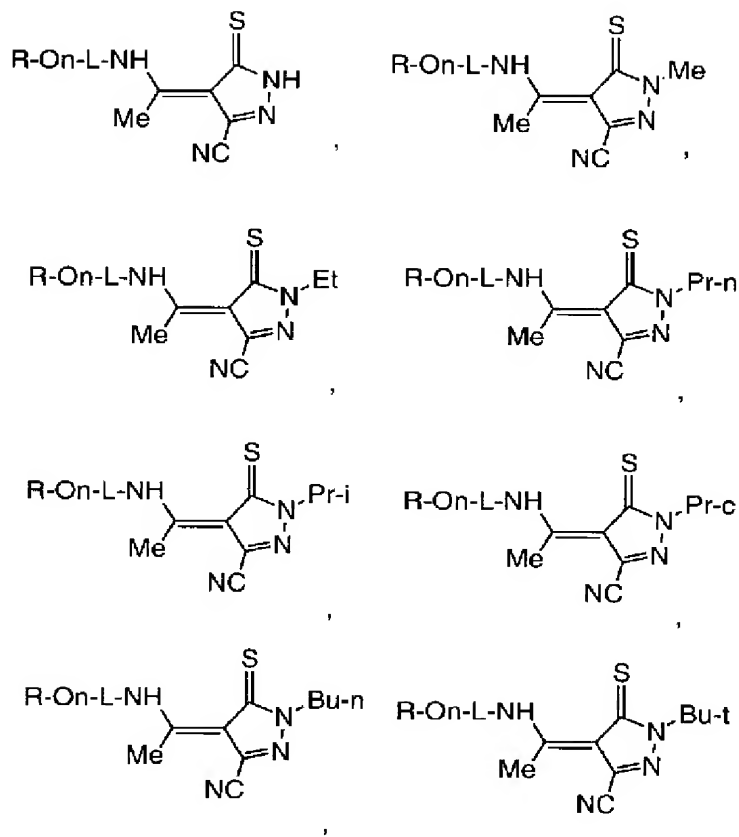
および表-7に示すが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

〔表-5〕
【0061】
【化19】



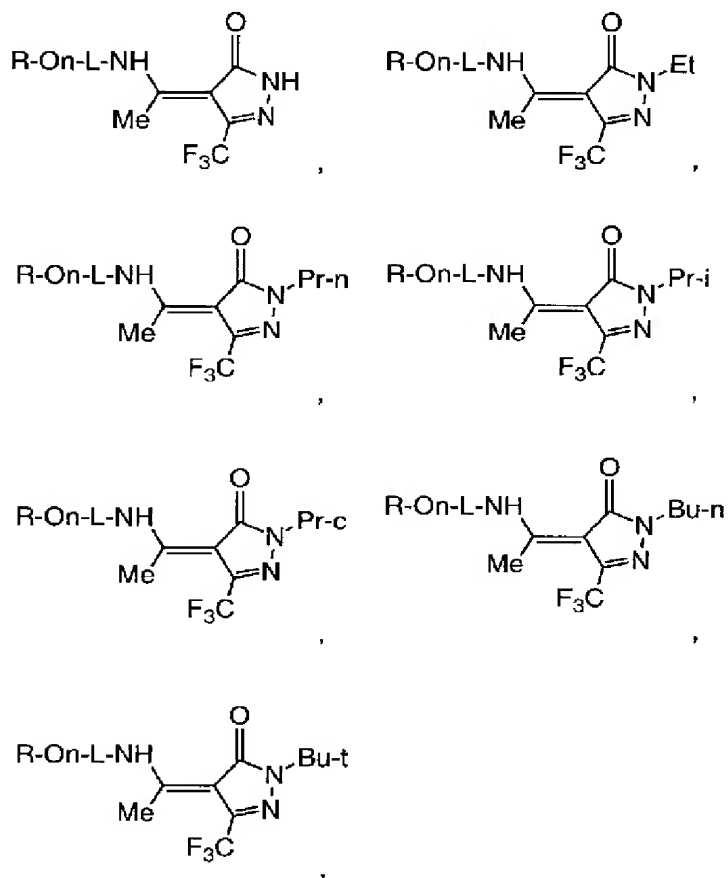
【0062】

【化20】



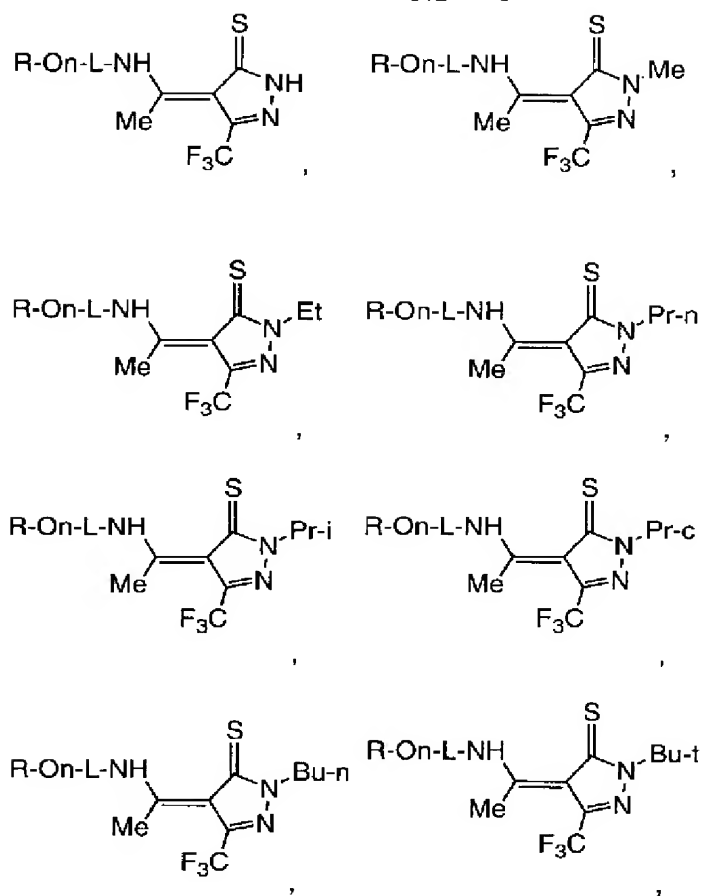
【0063】

【化21】



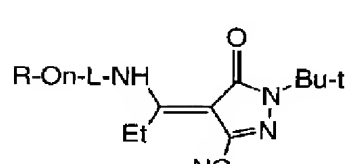
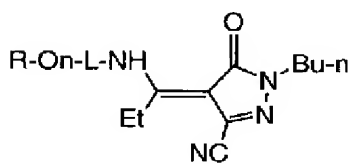
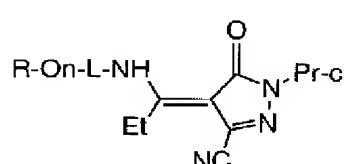
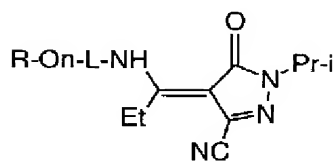
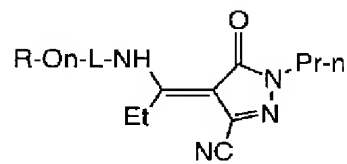
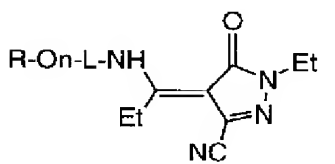
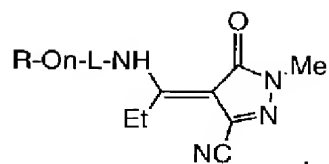
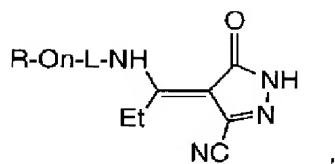
【0064】

【化22】



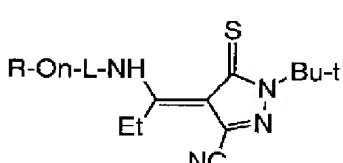
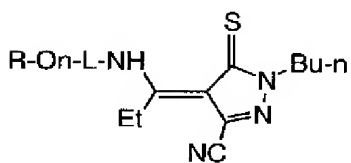
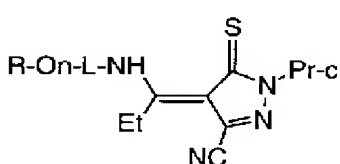
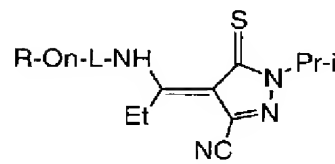
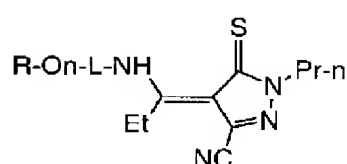
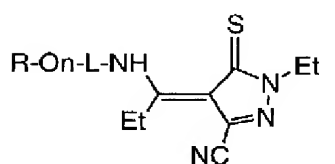
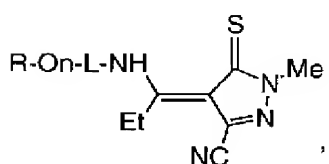
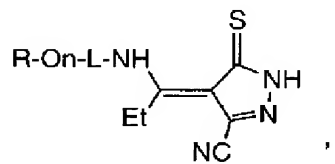
【0065】

【化23】



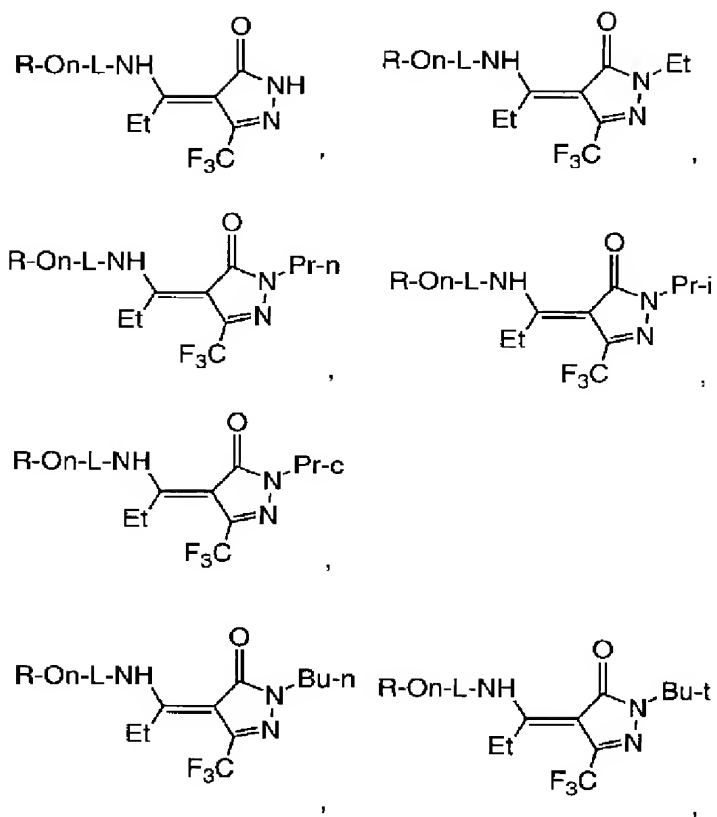
【0066】

【化24】



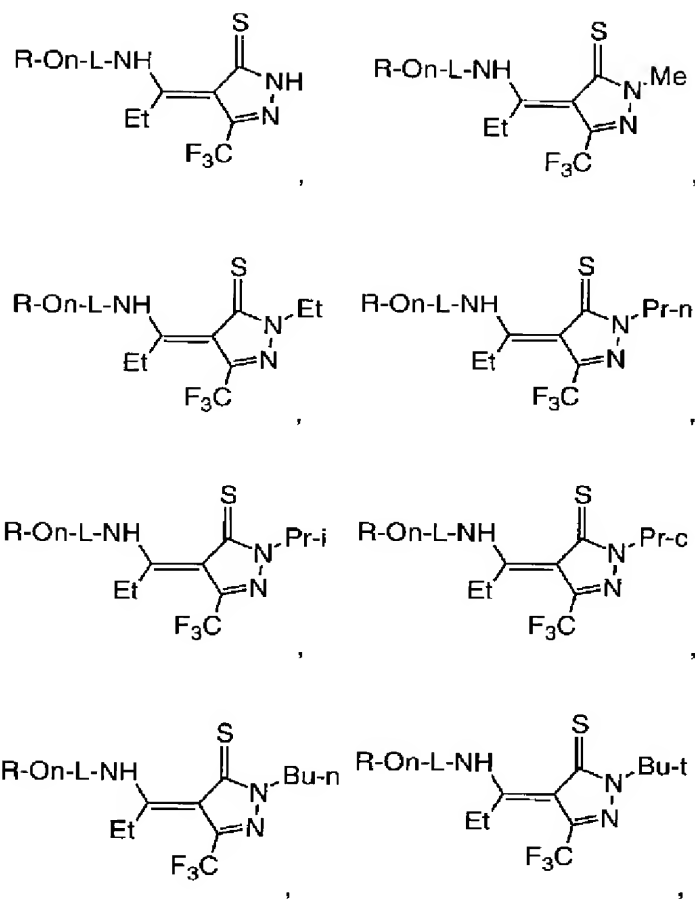
【0067】

【化25】



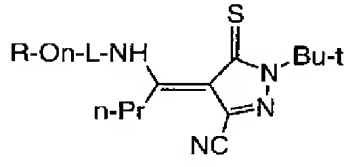
【0068】

【化26】



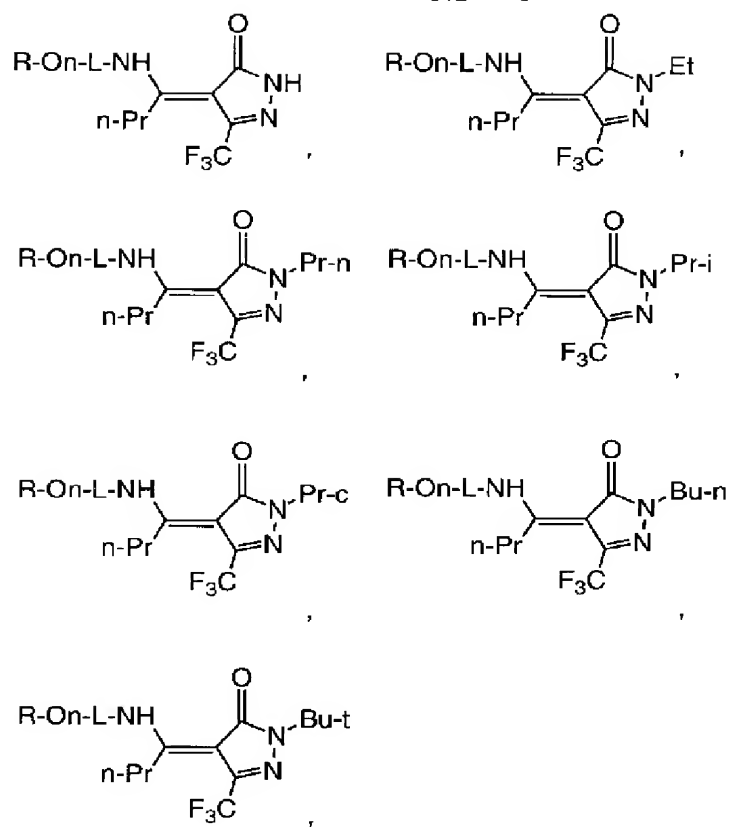
【0069】

【化27】



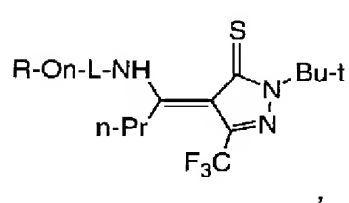
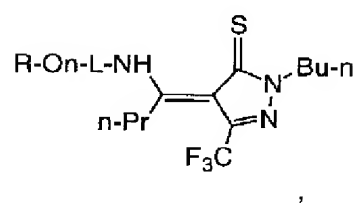
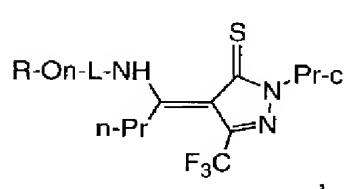
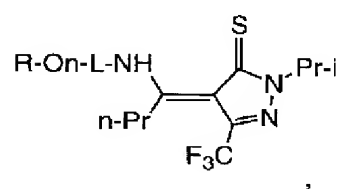
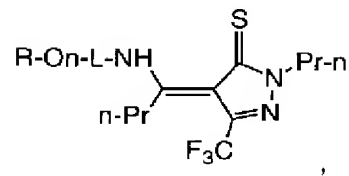
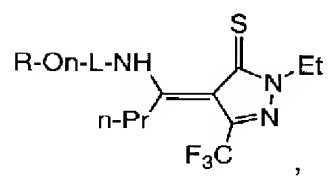
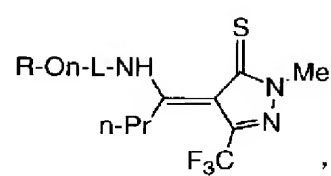
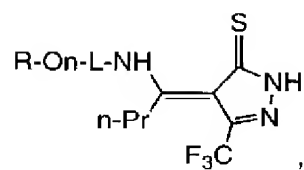
【0071】

【化29】



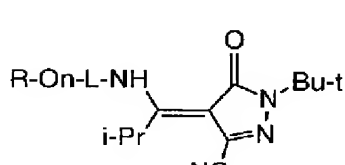
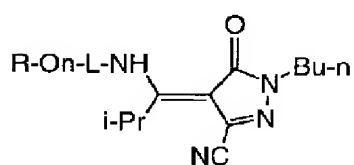
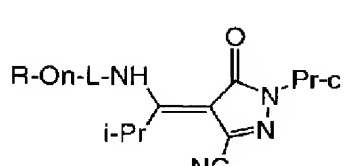
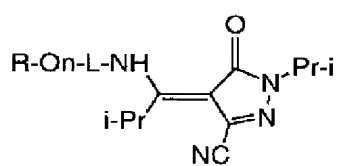
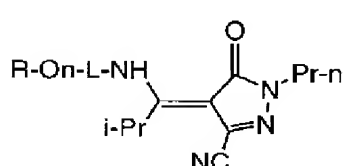
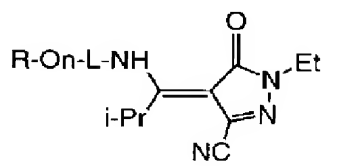
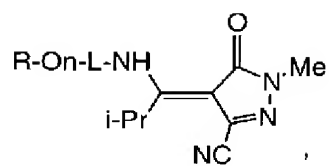
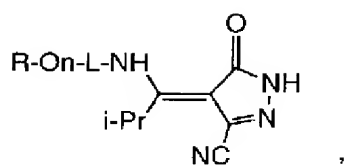
【0072】

【化30】



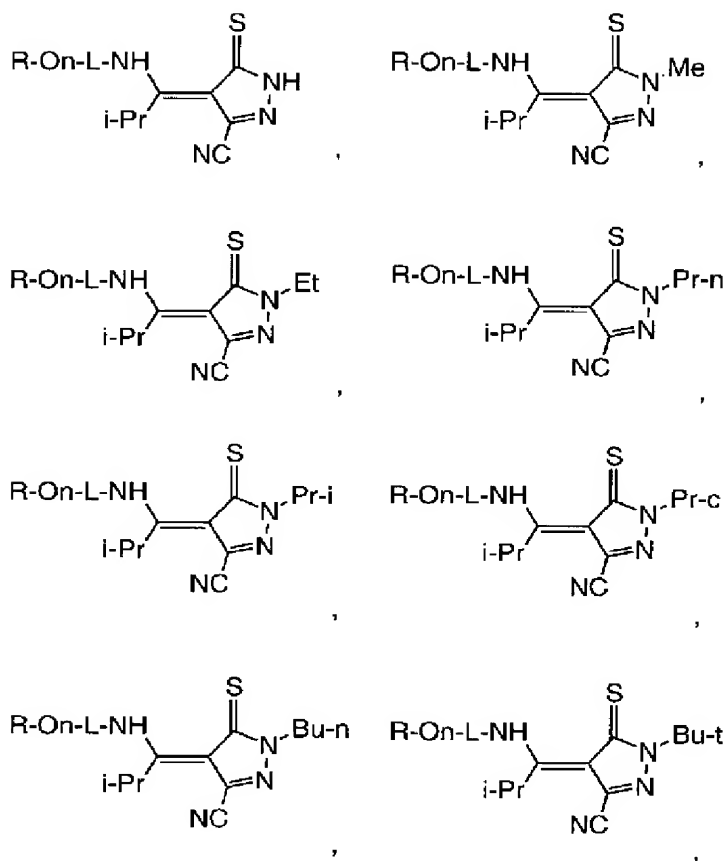
【0073】

【化31】



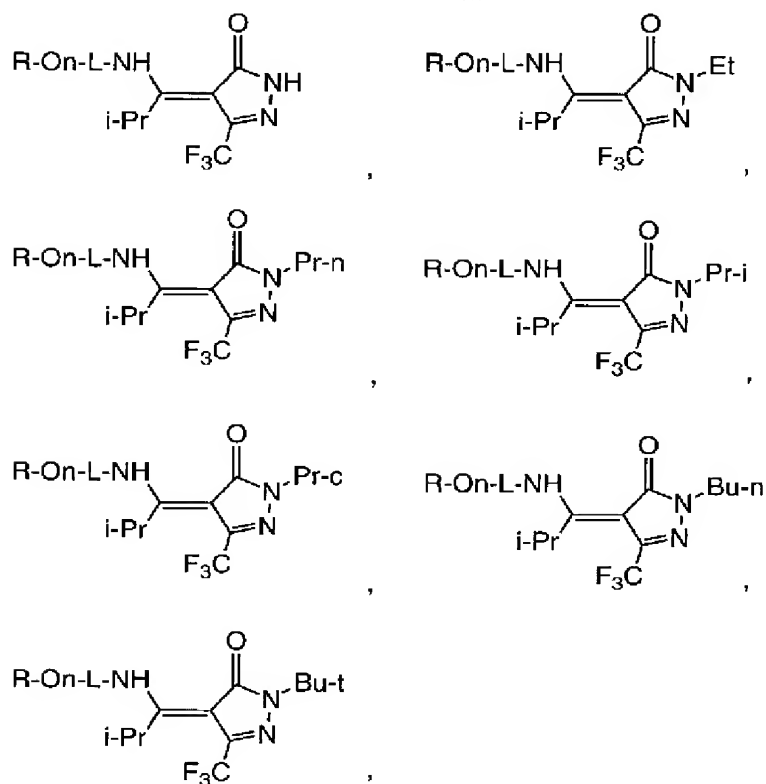
【0074】

【化32】



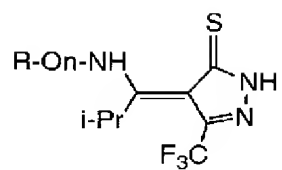
【0075】

【化33】

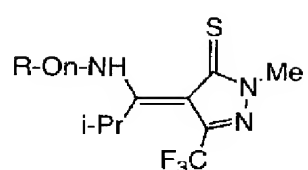


【0076】

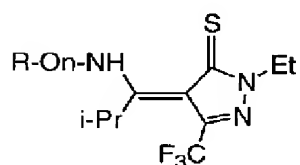
【化34】



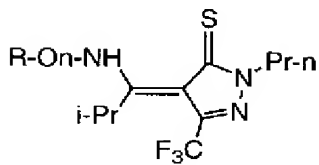
,



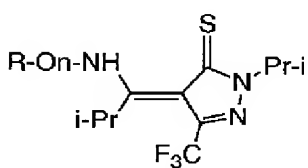
,



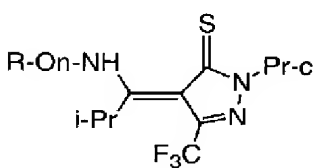
,



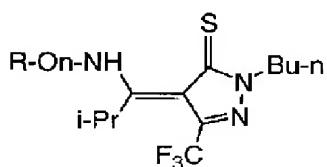
,



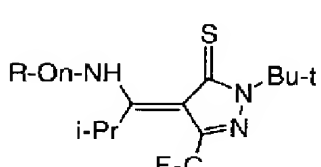
,



,



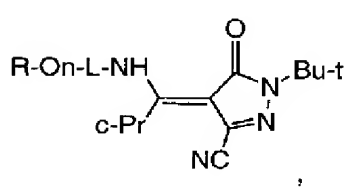
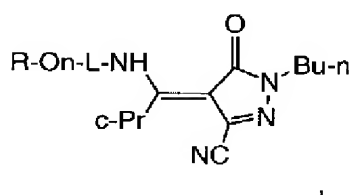
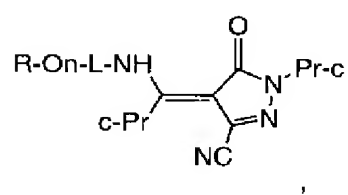
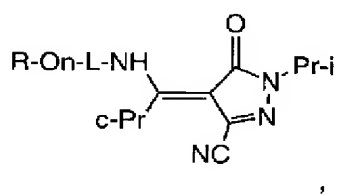
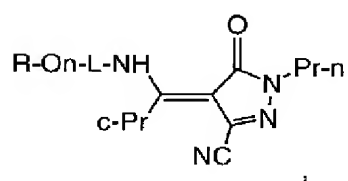
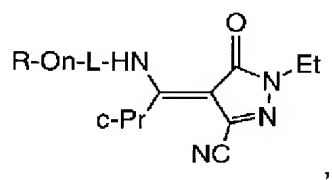
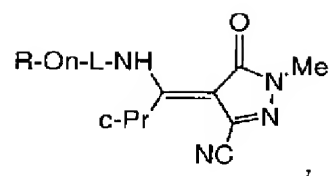
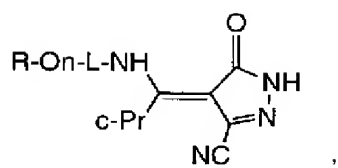
,



,

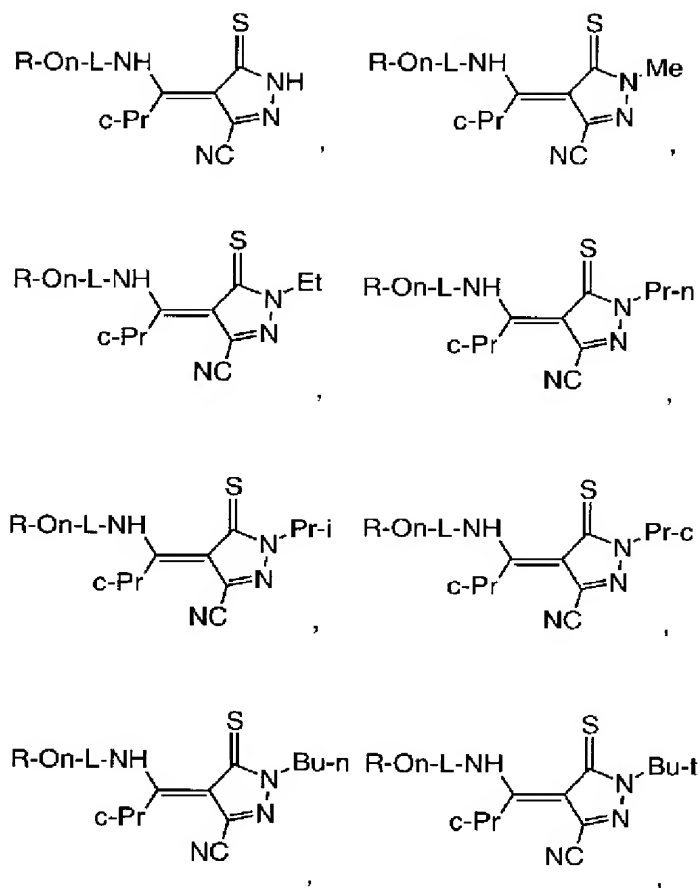
【0077】

【化35】



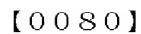
【0078】

【化36】

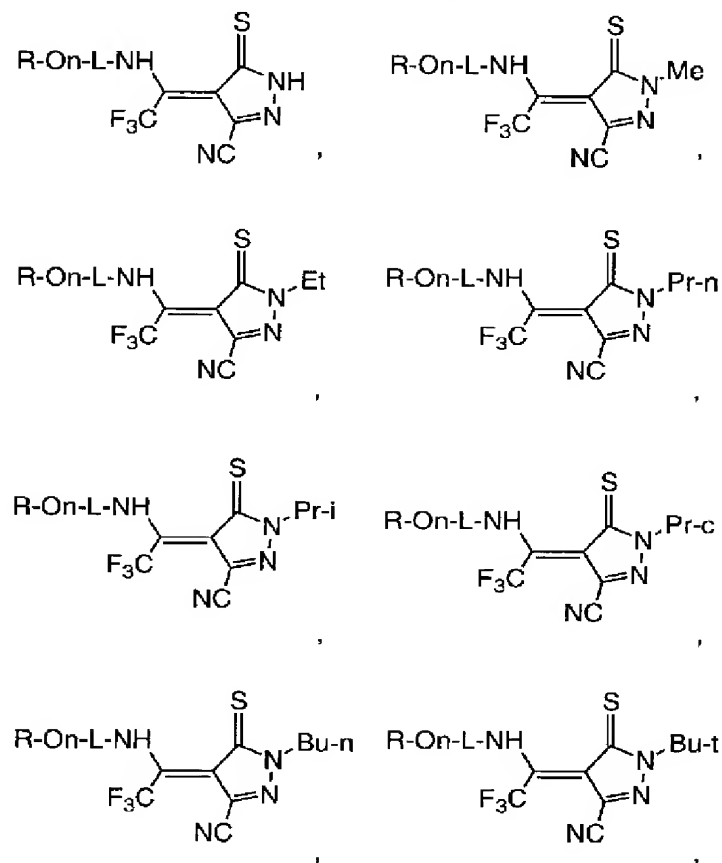


【0079】

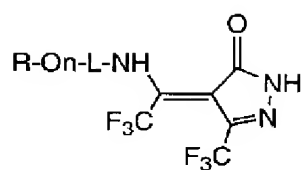
【化37】



【化38】

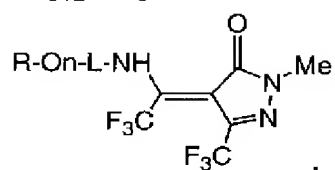


【0081】

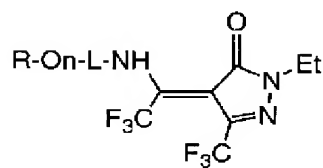


,

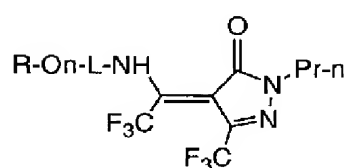
【化39】



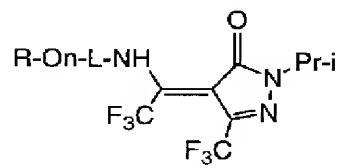
,



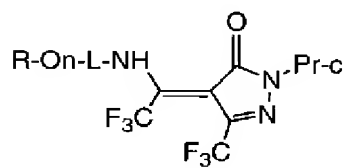
,



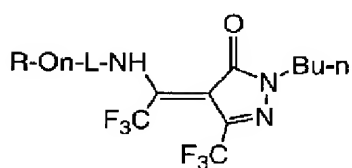
,



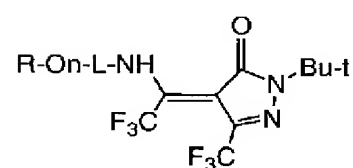
,



,



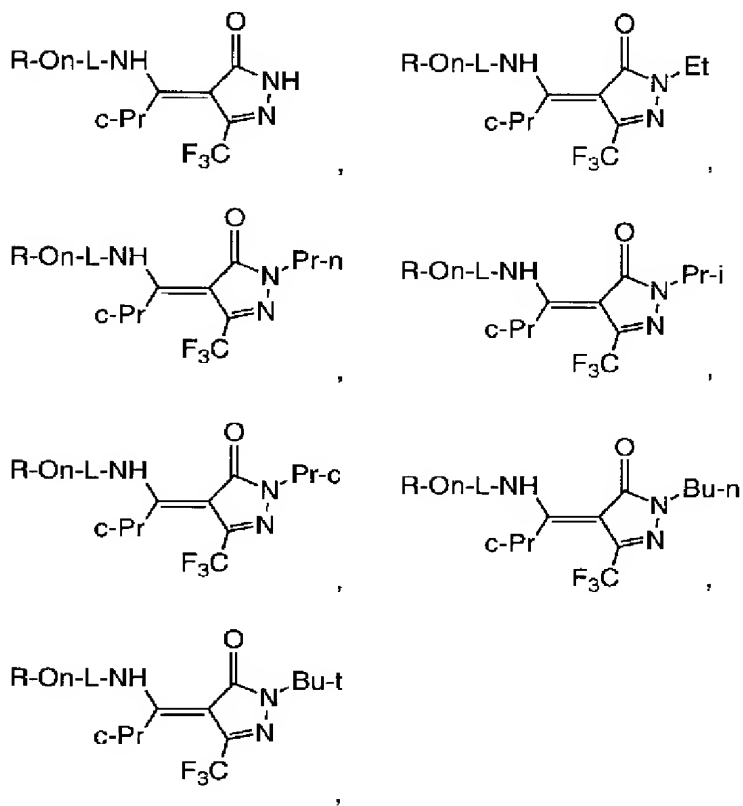
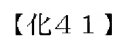
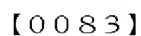
,



,

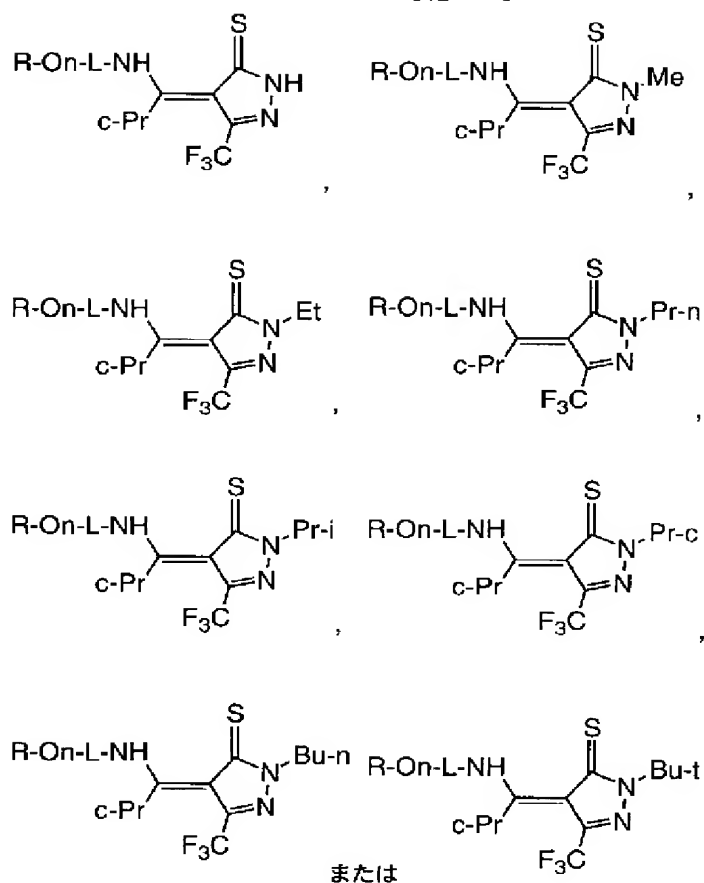
【0082】

【化40】



【0084】

【化42】



【0085】

【表9】

R-On-L-

PhCH₂, 2-F-PhCH₂, 3-F-PhCH₂, 4-F-PhCH₂, 2-Cl-PhCH₂, 3-Cl-PhCH₂, 4-Cl-PhCH₂, 2-Br-PhCH₂, 3-Br-PhCH₂, 4-Br-PhCH₂,
 2,4-F₂-PhCH₂, 3,4-F₂-PhCH₂, 2,4-Cl₂-PhCH₂, 3,4-Cl₂-PhCH₂,
 3,4,5-F₃-PhCH₂, 3,4,5-Cl₃-PhCH₂,
 2-F-4-Cl-PhCH₂, 3-F-4-Cl-PhCH₂, 3-Cl-4-F-PhCH₂, 2-Cl-4-Br-PhCH₂, 3-Cl-4-Br-PhCH₂, 3-Br-4-Cl-PhCH₂,
 2-F-3,4-Cl₂-PhCH₂, 3,4-Cl₂-5-F-PhCH₂, 3,4-Cl₂-6-F-PhCH₂,
 2-CF₃-PhCH₂, 3-CF₃-PhCH₂, 4-CF₃-PhCH₂,
 2,4-(CF₃)₂-PhCH₂, 3,4-(CF₃)₂-PhCH₂,
 2-F-3-CF₃-PhCH₂, 3-CF₃-4-F-PhCH₂, 3-CF₃-5-F-PhCH₂, 3-CF₃-6-F-PhCH₂, 2-F-4-CF₃-PhCH₂, 3-F-4-CF₃-PhCH₂,
 3-CF₃-4-Cl-PhCH₂, 2-Cl-4-CF₃-PhCH₂, 3-Cl-4-CF₃-PhCH₂,
 3-CF₃-4-Br-PhCH₂, 2-Br-4-CF₃-PhCH₂, 3-Br-4-CF₃-PhCH₂,

2,3-F₂-4-CF₃-PhCH₂, 3,4-F₂-5-CF₃-PhCH₂,
 2,3,5,6-F₄-4-CF₃-PhCH₂,
 2-Me-PhCH₂, 3-Me-PhCH₂, 4-Me-PhCH₂,

【0086】

【表10】

R-On-L-

2,4-Me₂-PhCH₂, 3,4-Me₂-PhCH₂,
 3-Me-4-F-PhCH₂, 2-F-4-Me-PhCH₂, 3-F-4-Me-PhCH₂,
 3-Me-4-Cl-PhCH₂, 2-Cl-4-Me-PhCH₂, 3-Cl-4-Me-PhCH₂,
 2-CF₃O-PhCH₂, 3-CF₃O-PhCH₂, 4-CF₃O-PhCH₂,
 2,4-(CF₃O)₂-PhCH₂, 3,4-(CF₃O)₂-PhCH₂,
 3-CF₃O-4-F-PhCH₂, 2-F-4-CF₃O-PhCH₂, 3-F-4-CF₃O-PhCH₂,
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH₂, 2-Cl-4-CF₃O-PhCH₂, 3-Cl-4-CF₃O-PhCH₂,
 2-CN-PhCH₂, 3-CN-PhCH₂, 4-CN-PhCH₂,
 2-NO₂-4-Cl-PhCH₂, 2,4-(NO₂)₂-PhCH₂, 3-NO₂-4-Me-PhCH₂,
 3-Me-4-NO₂-PhCH₂, 3-i-Pr-PhCH₂, 4-i-Pr-PhCH₂, 3,4-(i-Pr)₂-PhCH₂,
 PhCH₂CH₂, 2-F-PhCH₂CH₂, 3-F-PhCH₂CH₂, 4-F-PhCH₂CH₂,
 2-Cl-PhCH₂CH₂, 3-Cl-PhCH₂CH₂, 4-Cl-PhCH₂CH₂,
 2-Br-PhCH₂CH₂, 3-Br-PhCH₂CH₂, 4-Br-PhCH₂CH₂,
 2,4-F₂-PhCH₂CH₂, 3,4-F₂-PhCH₂CH₂, 2,4-Cl₂-PhCH₂CH₂,
 3,4-Cl₂-PhCH₂CH₂,
 3,4,5-F₃-PhCH₂CH₂, 3,4,5-Cl₃-PhCH₂CH₂,

【0087】

【表11】

R-On-L-

2-F-4-Cl-PhCH₂CH₂, 3-F-4-Cl-PhCH₂CH₂, 3-Cl-4-F-PhCH₂CH₂,
 2-Cl-4-Br-PhCH₂CH₂, 3-Cl-4-Br-PhCH₂CH₂, 3-Br-4-Cl-PhCH₂CH₂,
 2-F-3,4-Cl₂-PhCH₂CH₂, 3,4-Cl₂-5-F-PhCH₂CH₂, 3,4-Cl₂-6-F-PhCH₂CH₂,
 2-CF₃-PhCH₂CH₂, 3-CF₃-PhCH₂CH₂, 4-CF₃-PhCH₂CH₂,
 2,4-(CF₃)₂-PhCH₂CH₂, 3,4-(CF₃)₂-PhCH₂CH₂,
 2-F-3-CF₃-PhCH₂CH₂, 3-CF₃-4-F-PhCH₂CH₂, 3-CF₃-5-F-PhCH₂CH₂,
 3-CF₃-6-F-PhCH₂CH₂, 2-F-4-CF₃-PhCH₂CH₂, 3-F-4-CF₃-PhCH₂CH₂,
 3-CF₃-4-Cl-PhCH₂CH₂, 2-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH₂, 3-CF₃-4-Br-PhCH₂CH₂,
 2-Br-4-CF₃-PhCH₂CH₂, 3-Br-4-CF₃-PhCH₂CH₂,
 2,3-F₂-4-CF₃-PhCH₂CH₂, 3,4-F₂-5-CF₃-PhCH₂CH₂

2, 3, 5, 6-F₄-4-CF₃-PhCH₂CH₂,
 2-Me-PhCH₂CH₂, 3-Me-PhCH₂CH₂, 4-Me-PhCH₂CH₂,
 2,
 2, 4-Me₂-PhCH₂CH₂, 3, 4-Me₂-PhCH₂CH₂,
 3-Me-4-F-PhCH₂CH₂, 2-F-4-Me-PhCH₂CH₂, 3-F-4-
 -Me-PhCH₂CH₂,
 3-Me-4-Cl-PhCH₂CH₂, 2-Cl-4-Me-PhCH₂CH₂, 3-
 Cl-4-Me-PhCH₂CH₂,

【0088】

【表12】

R-On-L-

2-CF₃O-PhCH₂CH₂, 3-CF₃O-PhCH₂CH₂, 4-CF₃O-Ph
 CH₂CH₂,
 2, 4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH₂, 3, 4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH₂,
 3-CF₃O-4-F-PhCH₂CH₂, 2-F-4-CF₃O-PhCH₂CH₂, 3-
 -F-4-CF₃O-PhCH₂CH₂,
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH₂CH₂, 2-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH₂,
 , 3-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH₂,
 2-CN-PhCH₂CH₂, 3-CN-PhCH₂CH₂, 4-CN-PhCH₂CH₂,
 2,
 2-NO₂-4-Cl-PhCH₂CH₂, 2,4-(NO₂)₂-PhCH₂CH₂, 3-
 NO₂-4-Me-PhCH₂CH₂, 3-Me-4-NO₂-PhCH₂CH₂, 3-i-
 -Pr-PhCH₂CH₂, 4-i-Pr-PhCH₂CH₂, 3, 4-(i-Pr)₂-P
 hCH₂CH₂,
 PhCH₂CH₂CH₂, 2-F-PhCH₂CH₂CH₂, 3-F-PhCH₂CH₂CH₂,
 4-F-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-
 PhCH₂CH₂CH₂, 4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Br-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-Br-PhCH₂CH₂CH₂, 4-Br-PhCH₂CH₂CH₂,
 2, 4-F₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3, 4-F₂-PhCH₂CH₂CH₂, 2, 4-C
 l₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3, 4-Cl₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3, 4, 5-F₃-
 PhCH₂CH₂CH₂, 3, 4, 5-Cl₃-PhCH₂CH₂CH₂, 2-F-4-C
 l-PhCH₂CH₂CH₂, 3-F-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-4-
 -F-PhCH₂CH₂CH₂,

【0089】

【表13】

R-On-L-

2-Cl-4-Br-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-4-Br-PhCH₂CH₂
 CH₂, 3-Br-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-F-3,4-Cl₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3,4-Cl₂-5-F-PhCH₂CH₂CH₂,
 3,4-Cl₂-6-F-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 4-CF₃-
 PhCH₂CH₂CH₂,
 2, 4-(CF₃)₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3, 4-(CF₃)₂-PhCH₂CH₂CH₂,
 ,
 2-F-3-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃-4-F-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-CF₃-5-F-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃-6-F-PhCH₂CH₂CH₂

H_2CH_2 , 2-F-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3-F-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-CF₃-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-CF₃-4-Br-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Br-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-Br-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂,
 2,3-F₂-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3,4-F₂-5-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂,
 2,3,5,6-F₄-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-Me-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Me-PhCH₂CH₂CH₂, 4-Me-PhCH₂CH₂CH₂,
 2,4-(Me)₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3,4-(Me)₂-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-Me-4-F-PhCH₂CH₂CH₂, 2-F-4-Me-PhCH₂CH₂CH₂,

【0090】

【表14】

R-On-L-

3-F-4-Me-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-Me-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Cl-4-Me-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-Cl-4-Me-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂, 4-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂,
 2,4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3,4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-CF₃O-4-F-PhCH₂CH₂CH₂, 2-F-4-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-F-4-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-CN-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CN-PhCH₂CH₂CH₂, 4-CN-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-NO₂-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 2,4-(NO₂)₂-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-NO₂-4-Me-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Me-4-NO₂-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-i-Pr-PhCH₂CH₂CH₂, 4-i-Pr-PhCH₂CH₂CH₂,
 3,4-(i-Pr)₂-PhCH₂CH₂CH₂,
 PhCH(Me), 2-F-PhCH(Me), 3-F-PhCH(Me), 4-F-PhCH(Me),
 2-Cl-PhCH(Me), 3-Cl-PhCH(Me),
 4-Cl-PhCH(Me), 2-Br-PhCH(Me), 3-Br-PhCH(Me),
 4-Br-PhCH(Me),
 2,4-F₂-PhCH(Me), 3,4-F₂-PhCH(Me),

【0091】

【表15】

R-On-L-

2,4-Cl₂-PhCH(Me), 3,4-Cl₂-PhCH(Me),
 3,4,5-F₃-PhCH(Me), 3,4,5-Cl₃-PhCH(Me),
 2-F-4-Cl-PhCH(Me), 3-F-4-Cl-PhCH(Me), 3-Cl-4-F-PhCH(Me),
 2-Cl-4-Br-PhCH(Me), 3-C

1-4-Br-PhCH(Me), 3-Br-4-Cl-PhCH(Me),
 2-F-3,4-Cl₂-PhCH(Me), 3,4-Cl₂-5-F-PhCH(Me),
 3,4-Cl₂-6-F-PhCH(Me),
 2-CF₃-PhCH(Me), 3-CF₃-PhCH(Me), 4-CF₃-PhCH(Me),
 2,4-(CF₃)₂-PhCH(Me), 3,4-(CF₃)₂-PhCH(Me),
 2-F-3-CF₃-PhCH(Me), 3-CF₃-4-F-PhCH(Me), 3-CF₃-5-F-PhCH(Me), 3-CF₃-6-F-PhCH(Me), 2-F-4-CF₃-PhCH(Me), 3-F-4-CF₃-PhCH(Me), 3-CF₃-4-Cl-PhCH(Me), 2-Cl-4-CF₃-PhCH(Me), 3-Cl-4-CF₃-PhCH(Me), 3-CF₃-4-Br-PhCH(Me), 2-Br-4-CF₃-PhCH(Me), 3-Br-4-CF₃-PhCH(Me),
 ,
 2-F-3-F-4-CF₃-PhCH(Me), 3-F-4-F-5-CF₃-PhCH(Me),
 2,3,5,6-F₄-4-CF₃-PhCH(Me),
 2-Me-PhCH(Me), 3-Me-PhCH(Me), 4-Me-PhCH(Me),
 2,4-Me₂-PhCH(Me), 3,4-Me₂-PhCH(Me),

【0092】

【表16】

 R-On-L-

3-Me-4-F-PhCH(Me), 2-F-4-Me-PhCH(Me), 3-F-4-Me-PhCH(Me),
 3-Me-4-Cl-PhCH(Me), 2-Cl-4-Me-PhCH(Me), 3-Cl-4-Me-PhCH(Me),
 2-CF₃O-PhCH(Me), 3-CF₃O-PhCH(Me), 4-CF₃O-PhCH(Me),
 2,4-(CF₃O)₂-PhCH(Me), 3,4-(CF₃O)₂-PhCH(Me),
 3-CF₃O-4-F-PhCH(Me), 2-F-4-CF₃O-PhCH(Me),
 3-F-4-CF₃O-PhCH(Me),
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH(Me), 2-Cl-4-CF₃O-PhCH(Me), 3-Cl-4-CF₃O-PhCH(Me), 2-CN-PhCH(Me),
 3-CN-PhCH(Me), 4-CN-PhCH(Me), 2-NO₂-4-Cl-PhCH(Me), 2,4-(NO₂)₂-PhCH(Me), 3-NO₂-4-Me-PhCH(Me), 3-Me-4-NO₂-PhCH(Me), 3-i-Pr-PhCH(Me), 4-i-Pr-PhCH(Me), 3,4-(i-Pr)₂-PhCH(Me),
 PhC(Me)₂, 2-F-PhC(Me)₂, 3-F-PhC(Me)₂, 4-F-PhC(Me)₂, 2-Cl-PhC(Me)₂, 3-Cl-PhC(Me)₂, 4-Cl-PhC(Me)₂, 2-Br-PhC(Me)₂, 3-Br-PhC(Me)₂, 4-Br-PhC(Me)₂,
 2,4-F₂-PhC(Me)₂, 3,4-F₂-PhC(Me)₂,

【0093】

【表17】

 R-On-L-

2, 4-Cl₂-PhC (Me)₂, 3, 4-Cl₂-PhC (Me)₂,
 3, 4, 5-F₃-PhC (Me)₂, 3, 4, 5-Cl₃-PhC (Me)₂,
 2-F-4-Cl-PhC (Me)₂, 3-F-4-Cl-PhC (Me)₂, 3-Cl-
 1-4-F-PhC (Me)₂, 2-Cl-4-Br-PhC (Me)₂, 3-Cl-
 4-Br-PhC (Me)₂, 3-Br-4-Cl-PhC (Me)₂,
 2-F-3,4-Cl₂-PhC (Me)₂, 3,4-Cl₂-5-F-PhC (Me)₂,
 3,4-Cl₂-6-F-PhC (Me)₂,
 2-CF₃-PhC (Me)₂, 3-CF₃-PhC (Me)₂, 4-CF₃-PhC (Me)₂,
 2, 4-(CF₃)₂-PhC (Me)₂, 3, 4-(CF₃)₂-PhC (Me)₂,
 2-F-3-CF₃-PhC (Me)₂, 3-CF₃-4-F-PhC (Me)₂, 3-
 CF₃-5-F-PhC (Me)₂, 3-CF₃-6-F-PhC (Me)₂, 2-F-
 4-CF₃-PhC (Me)₂, 3-F-4-CF₃-PhC (Me)₂,
 3-CF₃-4-Cl-PhC (Me)₂, 2-Cl-4-CF₃-PhC (Me)₂,
 3-Cl-4-CF₃-PhC (Me)₂,
 3-CF₃-4-Br-PhC (Me)₂, 2-Br-4-CF₃-PhC (Me)₂,
 3-Br-4-CF₃-PhC (Me)₂,
 2-F-3-F-4-CF₃-PhC (Me)₂, 3-F-4-F-5-CF₃-PhC (Me)₂,
 2, 3, 5, 6-F₄-4-CF₃-PhC (Me)₂,
 2-Me-PhC (Me)₂, 3-Me-PhC (Me)₂, 4-Me-PhC (Me)₂,

【0094】

【表18】

R-On-L-

2, 4-Me₂-PhC (Me)₂, 3, 4-Me₂-PhC (Me)₂,
 3-Me-4-F-PhC (Me)₂, 2-F-4-Me-PhC (Me)₂, 3-F-
 4-Me-PhC (Me)₂,
 3-Me-4-Cl-PhC (Me)₂, 2-Cl-4-Me-PhC (Me)₂, 3-
 Cl-4-Me-PhC (Me)₂,
 2-CF₃O-PhC (Me)₂, 3-CF₃O-PhC (Me)₂, 4-CF₃O-PhC (Me)₂,
 2, 4-(CF₃O)₂-PhC (Me)₂, 3, 4-(CF₃O)₂-PhC (Me)₂,
 3-CF₃O-4-F-PhC (Me)₂, 2-F-4-CF₃O-PhC (Me)₂,
 3-F-4-CF₃O-PhC (Me)₂,
 3-CF₃O-4-Cl-PhC (Me)₂, 2-Cl-4-CF₃O-PhC (Me)₂, 3-Cl-4-CF₃O-PhC (Me)₂, 2-CN-PhC (Me)₂, 3-CN-PhC (Me)₂, 4-CN-PhC (Me)₂,
 2-NO₂-4-Cl-PhC (Me)₂, 2,4-(NO₂)₂-PhC (Me)₂, 3-
 NO₂-4-Me-PhC (Me)₂, 3-Me-4-NO₂-PhC (Me)₂, 3-
 i-Pr-PhC (Me)₂, 4-i-Pr-PhC (Me)₂, 3, 4-(i-Pr)₂-PhC (Me)₂,
 PhCH (Me) CH₂, 2-F-PhCH (Me) CH₂, 3-F-PhCH (Me) CH₂, 4-F-PhCH (Me) CH₂, 2-Cl-PhCH (Me) CH₂, 3-Cl-PhCH (Me) CH₂, 4-Cl-PhCH (Me) CH₂, 2-Br-PhCH (Me) CH₂, 3-Br-PhCH (Me) CH₂, 4-Br-Ph

CH (Me) CH₂,

【0095】

【表19】

R-On-L-

2, 4-F₂-PhCH (Me) CH₂, 3, 4-F₂-PhCH (Me) CH₂, 2, 4-Cl₂-PhCH (Me) CH₂, 3, 4-Cl₂-PhCH (Me) CH₂, 3, 4, 5-F₃-PhCH (Me) CH₂, 3, 4, 5-Cl₃-PhCH (Me) CH₂, 2-F-4-Cl-PhCH (Me) CH₂, 3-F-4-Cl-PhCH (Me) CH₂, 3-Cl-4-F-PhCH (Me) CH₂, 2-Cl-4-Br-PhCH (Me) CH₂, 3-Cl-4-Br-PhCH (Me) CH₂, 3-Br-4-Cl-PhCH (Me) CH₂, 2-F-3,4-Cl₂-PhCH (Me) CH₂, 3,4-Cl₂-5-F-PhCH (Me) CH₂, 3,4-Cl₂-6-F-PhCH (Me) CH₂, 2-CF₃-PhCH (Me) CH₂, 3-CF₃-PhCH (Me) CH₂, 4-CF₃-PhCH (Me) CH₂, 2, 4-(CF₃)₂-PhCH (Me) CH₂, 3, 4-(CF₃)₂-PhCH (Me) CH₂, 2-F-3-CF₃-PhCH (Me) CH₂, 3-CF₃-4-F-PhCH (Me) CH₂, 3-CF₃-5-F-PhCH (Me) CH₂, 3-CF₃-6-F-PhCH (Me) CH₂, 2-F-4-CF₃-PhCH (Me) CH₂, 3-F-4-CF₃-PhCH (Me) CH₂, 3-CF₃-4-Cl-PhCH (Me) CH₂, 2-Cl-4-CF₃-PhCH (Me) CH₂, 3-Cl-4-CF₃-PhCH (Me) CH₂, 3-CF₃-4-Br-PhCH (Me) CH₂, 2-Br-4-CF₃-PhCH (Me) CH₂, 3-Br-4-CF₃-PhCH (Me) CH₂, 2,3-F₂-4-CF₃-PhCH (Me) CH₂,

【0096】

【表20】

R-On-L-

3,4-F₂-5-CF₃-PhCH (Me) CH₂, 2, 3, 5, 6-F₄-4-CF₃-PhCH (Me) CH₂, 2-Me-PhCH (Me) CH₂, 3-Me-PhCH (Me) CH₂, 4-Me-PhCH (Me) CH₂, 2, 4-Me₂-PhCH (Me) CH₂, 3, 4-Me₂-PhCH (Me) CH₂, 3-Me-4-F-PhCH (Me) CH₂, 2-F-4-Me-PhCH (Me) CH₂, 3-F-4-Me-PhCH (Me) CH₂, 3-Me-4-Cl-PhCH (Me) CH₂, 2-Cl-4-Me-PhCH (Me) CH₂, 3-Cl-4-Me-PhCH (Me) CH₂, 2-CF₃O-PhCH (Me) CH₂, 3-CF₃O-PhCH (Me) CH₂, 4-CF₃O-PhCH (Me) CH₂, 2, 4-(CF₃O)₂-PhCH (Me) CH₂, 3, 4-(CF₃O)₂-PhCH (Me) CH₂, 3-CF₃O-4-F-PhCH (Me) CH₂, 2-F-4-CF₃O-PhCH (Me) CH₂, 3-F-4-CF₃O-PhCH (Me) CH₂,

3-CF₃O-4-Cl-PhCH(Me)CH₂, 2-Cl-4-CF₃O-PhCH
H(Me)CH₂, 3-Cl-4-CF₃O-PhCH(Me)CH₂,
2-CN-PhCH(Me)CH₂, 3-CN-PhCH(Me)CH₂, 4-CN
-PhCH(Me)CH₂,
2-NO₂-4-Cl-PhCH(Me)CH₂, 2,4-(NO₂)₂-PhCH(Me)
)CH₂, 3-NO₂-4-Me-PhCH(Me)CH₂, 3-Me-4-NO₂-
PhCH(Me)CH₂, 3-i-Pr-PhCH(Me)CH₂, 4-i-Pr-
PhCH(Me)CH₂, 3,4-(i-Pr)₂-PhCH(Me)CH₂,

【0097】

【表21】

R-On-L-

PhCH₂CH(Me), 2-F-PhCH₂CH(Me), 3-F-PhCH₂C
H(Me), 4-F-PhCH₂CH(Me), 2-Cl-PhCH₂CH(Me)
, 3-Cl-PhCH₂CH(Me), 4-Cl-PhCH₂CH(Me), 2-B
r-PhCH₂CH(Me), 3-Br-PhCH₂CH(Me), 4-Br-Ph
CH₂CH(Me), 2,4-F₂-PhCH₂CH(Me), 3,4-F₂-PhCH
₂CH(Me), 2,4-Cl₂-PhCH₂CH(Me), 3,4-Cl₂-PhCH
₂CH(Me), 3,4,5-F₃-PhCH₂CH(Me), 3,4,5-Cl₃-Ph
CH₂CH(Me),
2-F-4-Cl-PhCH₂CH(Me), 3-F-4-Cl-PhCH₂CH(M
e), 3-Cl-4-F-PhCH₂CH(Me), 2-Cl-4-Br-PhCH₂
CH(Me), 3-Cl-4-Br-PhCH₂CH(Me), 3-Br-4-Cl
-PhCH₂CH(Me),
2-F-3,4-Cl₂-PhCH₂CH(Me), 3,4-Cl₂-5-F-PhCH₂C
H(Me), 4,5-Cl₂-2-F-PhCH₂CH(Me),
2-CF₃-PhCH₂CH(Me), 3-CF₃-PhCH₂CH(Me), 4-C
F₃-PhCH₂CH(Me),
2,4-(CF₃)₂-PhCH₂CH(Me), 3,4-(CF₃)₂-PhCH₂CH(M
e),
2-F-3-CF₃-PhCH₂CH(Me), 3-CF₃-4-F-PhCH₂CH
(Me), 3-CF₃-5-F-PhCH₂CH(Me), 3-CF₃-6-F-Ph
CH₂CH(Me), 2-F-4-CF₃-PhCH₂CH(Me), 3-F-4-C
F₃-PhCH₂CH(Me),
3-CF₃-4-Cl-PhCH₂CH(Me),

【0098】

【表22】

R-On-L-

2-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH(Me), 3-Cl-4-CF₃-PhCH₂
CH(Me),
3-CF₃-4-Br-PhCH₂CH(Me), 2-Br-4-CF₃-PhCH₂C
H(Me), 3-Br-4-CF₃-PhCH₂CH(Me),
2,3-F₂-4-CF₃-PhCH₂CH(Me), 3,4-F₂-5-CF₃-PhCH₂
CH(Me),
2,3,5,6-F₄-4-CF₃-PhCH₂CH(Me),
2-Me-PhCH₂CH(Me), 3-Me-PhCH₂CH(Me), 4-Me
-PhCH₂CH(Me),

2, 4-Me₂-PhCH₂CH(Me), 3, 4-Me₂-PhCH₂CH(Me),
 3-Me-4-F-PhCH₂CH(Me), 2-F-4-Me-PhCH₂CH(Me),
 3-F-4-Me-PhCH₂CH(Me),
 3-Me-4-Cl-PhCH₂CH(Me), 2-Cl-4-Me-PhCH₂CH(Me),
 3-Cl-4-Me-PhCH₂CH(Me),
 2-CF₃O-PhCH₂CH(Me), 3-CF₃O-PhCH₂CH(Me), 4-
 -CF₃O-PhCH₂CH(Me),
 2, 4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH(Me), 3, 4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH
 (Me),
 3-CF₃O-4-F-PhCH₂CH(Me), 2-F-4-CF₃O-PhCH₂C
 H(Me), 3-F-4-CF₃O-PhCH₂CH(Me),
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH₂CH(Me), 2-Cl-4-CF₃O-PhC
 H₂CH(Me), 3-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH(Me),
 2-CN-PhCH₂CH(Me), 3-CN-PhCH₂CH(Me),

【0099】

【表23】

R-On-L-

4-CN-PhCH₂CH(Me),
 2-NO₂-4-Cl-PhCH₂CH(Me), 2,4-(NO₂)₂-PhCH₂CH
 (Me), 3-NO₂-4-Me-PhCH₂CH(Me), 3-Me-4-NO₂-
 PhCH₂CH(Me), 3-i-Pr-PhCH₂CH(Me), 4-i-Pr-
 PhCH₂CH(Me), 3, 4-(i-Pr)₂-PhCH₂CH(Me),
 PhCH₂C(Me)₂, 2-F-PhCH₂C(Me)₂, 3-F-PhCH₂C(
 Me)₂, 4-F-PhCH₂C(Me)₂, 2-Cl-PhCH₂C(Me)₂, 3-
 Cl-PhCH₂C(Me)₂, 4-Cl-PhCH₂C(Me)₂, 2-Br-Ph
 CH₂C(Me)₂, 3-Br-PhCH₂C(Me)₂, 4-Br-PhCH₂C(
 Me)₂,
 2, 4-F₂-PhCH₂C(Me)₂, 3, 4-F₂-PhCH₂C(Me)₂, 2, 4-
 Cl₂-PhCH₂C(Me)₂, 3, 4-Cl₂-PhCH₂C(Me)₂,
 3, 4, 5-F₃-PhCH₂C(Me)₂, 3, 4, 5-Cl₃-PhCH₂C(Me)₂
 ,
 2-F-4-Cl-PhCH₂C(Me)₂, 3-F-4-Cl-PhCH₂C(Me)
)₂, 3-Cl-4-F-PhCH₂C(Me)₂, 2-Cl-4-Br-PhCH₂C
 (Me)₂, 3-Cl-4-Br-PhCH₂C(Me)₂, 3-Br-4-Cl-P
 hCH₂C(Me)₂,
 2-F-3,4-Cl₂-PhCH₂C(Me)₂, 3,4-Cl₂-5-F-PhCH₂C
 (Me)₂, 3,4-Cl₂-6-F-PhCH₂C(Me)₂,
 2-CF₃-PhCH₂C(Me)₂, 3-CF₃-PhCH₂C(Me)₂, 4-CF₃
 -PhCH₂C(Me)₂,
 2, 4-(CF₃)₂-PhCH₂C(Me)₂,

【0100】

【表24】

R-On-L-

3, 4-(CF₃)₂-PhCH₂C(Me)₂,
 2-F-3-CF₃-PhCH₂C(Me)₂, 3-CF₃-4-F-PhCH₂C(M
 e)₂, 3-CF₃-5-F-PhCH₂C(Me)₂, 3-CF₃-6-F-PhCH₂

$C(Me)_2$, 2-F-4-CF₃-PhCH₂C(Me)₂, 3-F-4-CF₃-PhCH₂C(Me)₂,
 3-CF₃-4-Cl-PhCH₂C(Me)₂, 2-Cl-4-CF₃-PhCH₂C(Me)₂, 3-Cl-4-CF₃-PhCH₂C(Me)₂,
 3-CF₃-4-Br-PhCH₂C(Me)₂, 2-Br-4-CF₃-PhCH₂C(Me)₂, 3-Br-4-CF₃-PhCH₂C(Me)₂,
 2,3-F₂-4-CF₃-PhCH₂C(Me)₂, 3,4-F₂-5-CF₃-PhCH₂C(Me)₂,
 2,3,5,6-F₄-4-CF₃-PhCH₂C(Me)₂,
 2-Me-PhCH₂C(Me)₂, 3-Me-PhCH₂C(Me)₂, 4-Me-PhCH₂C(Me)₂,
 2,4-Me₂-PhCH₂C(Me)₂, 3,4-Me₂-PhCH₂C(Me)₂,
 3-Me-4-F-PhCH₂C(Me)₂, 2-F-4-Me-PhCH₂C(Me)₂, 3-F-4-Me-PhCH₂C(Me)₂,
 3-Me-4-Cl-PhCH₂C(Me)₂, 2-Cl-4-Me-PhCH₂C(Me)₂, 3-Cl-4-Me-PhCH₂C(Me)₂,
 2-CF₃O-PhCH₂C(Me)₂, 3-CF₃O-PhCH₂C(Me)₂, 4-CF₃O-PhCH₂C(Me)₂,
 2,4-(CF₃O)₂-PhCH₂C(Me)₂, 3,4-(CF₃O)₂-PhCH₂C(Me)₂.

【0101】

【表25】

R-On-L-

3-CF₃O-4-F-PhCH₂C(Me)₂, 2-F-4-CF₃O-PhCH₂C(Me)₂, 3-F-4-CF₃O-PhCH₂C(Me)₂,
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH₂C(Me)₂, 2-Cl-4-CF₃O-PhCH₂C(Me)₂, 3-Cl-4-CF₃O-PhCH₂C(Me)₂,
 2-CN-PhCH₂C(Me)₂, 3-CN-PhCH₂C(Me)₂, 4-CN-PhCH₂C(Me)₂,
 2-NO₂-4-Cl-PhCH₂C(Me)₂, 2,4-(NO₂)₂-PhCH₂C(Me)₂, 3-NO₂-4-Me-PhCH₂C(Me)₂, 3-Me-4-NO₂-PhCH₂C(Me)₂,
 3-i-Pr-PhCH₂C(Me)₂, 4-i-Pr-PhCH₂C(Me)₂, 3,4-(i-Pr)₂-PhCH₂C(Me)₂,
 PhCH(COOMe), 2-F-PhCH(COOMe), 3-F-PhCH(COOMe), 4-F-PhCH(COOMe), 2-Cl-PhCH(COOMe),
 3-Cl-PhCH(COOMe), 4-Cl-PhCH(COOMe), 2-Br-PhCH(COOMe), 3-Br-PhCH(COOMe),
 4-Br-PhCH(COOMe), 2,4-F₂-PhCH(COOMe), 3,4-F₂-PhCH(COOMe), 2,4-Cl₂-PhCH(COOMe),
 3,4-Cl₂-PhCH(COOMe),
 3,4,5-F₃-PhCH(COOMe), 3,4,5-Cl₃-PhCH(COOMe),
 2-F-4-Cl-PhCH(COOMe), 3-F-4-Cl-PhCH(COOMe), 3-Cl-4-F-PhCH(COOMe), 2-Cl-4-Br-PhCH(COOMe),
 3-Cl-4-Br-PhCH(COOMe).

【0102】

【表26】

R-On-L-

3-Br-4-Cl-PhCH(COOMe),
 2-F-3,4-Cl₂-PhCH(COOMe), 3,4-Cl₂-5-F-PhCH(COOMe),
 3,4-Cl₂-6-F-PhCH(COOMe),
 2-CF₃-PhCH(COOMe), 3-CF₃-PhCH(COOMe), 4-CF₃-PhCH(COOMe),
 2,4-(CF₃)₂-PhCH(COOMe), 3,4-(CF₃)₂-PhCH(COOMe),
 2-F-3-CF₃-PhCH(COOMe), 3-CF₃-4-F-PhCH(COOMe),
 3-CF₃-5-F-PhCH(COOMe), 3-CF₃-6-F-PhCH(COOMe),
 2-F-4-CF₃-PhCH(COOMe), 3-F-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 3-CF₃-4-Cl-PhCH(COOMe), 2-Cl-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 3-Cl-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 3-CF₃-4-Br-PhCH(COOMe), 2-Br-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 3-Br-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 2-F-3-F-4-CF₃-PhCH(COOMe), 3-F-4-F-5-CF₃-PhCH(COOMe),
 2,3,5,6-F₄-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 2-Me-PhCH(COOMe), 3-Me-PhCH(COOMe), 4-Me-PhCH(COOMe),
 2,4-Me₂-PhCH(COOMe), 3,4-Me₂-PhCH(COOMe),
 3-Me-4-F-PhCH(COOMe), 2-F-4-Me-PhCH(COOMe),
 3-F-4-Me-PhCH(COOMe),

【0103】

【表27】

R-On-L-

3-Me-4-Cl-PhCH(COOMe), 2-Cl-4-Me-PhCH(COOMe),
 3-Cl-4-Me-PhCH(COOMe),
 2-CF₃O-PhCH(COOMe), 3-CF₃O-PhCH(COOMe),
 4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 2,4-(CF₃O)₂-PhCH(COOMe), 3,4-(CF₃O)₂-PhCH(COOMe),
 3-CF₃O-4-F-PhCH(COOMe), 2-F-4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 3-F-4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH(COOMe), 2-Cl-4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 3-Cl-4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 2-CN-PhCH(COOMe), 3-CN-PhCH(COOMe), 4-CN-PhCH(COOMe),
 2-NO₂-4-Cl-PhCH(COOMe), 2,4-(NO₂)₂-PhCH(COOMe),
 3-NO₂-4-Me-PhCH(COOMe), 3-Me-4-NO₂-PhCH(COOMe),
 3-i-Pr-PhCH(COOMe), 4-i-Pr-PhCH(COOMe),
 3,4-(i-Pr)₂-PhCH(COOMe), PhCH₂CH(COOMe),
 2-F-PhCH₂CH(COOMe), 3-F-PhCH₂CH(COOMe),
 4-F-PhCH₂CH(COOMe), 2-Cl-PhCH₂CH(COOMe),
 3-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 4

-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 2-Br-PhCH₂CH(COOMe), 3-Br-PhCH₂CH(COOMe), 4-Br-PhCH₂CH(COOMe), 2,4-F₂-PhCH₂CH(COOMe), 3,4-F₂-PhCH₂CH(COOMe), 2,4-Cl₂-PhCH₂CH(COOMe),

【0104】

【表28】

R-On-L-

3,4-Cl₂-PhCH₂CH(COOMe),
 3,4,5-F₃-PhCH₂CH(COOMe), 3,4,5-Cl₃-PhCH₂CH(COOMe),
 2-F-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 3-F-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-4-F-PhCH₂CH(COOMe), 2-Cl-4-Br-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-4-Br-PhCH₂CH(COOMe), 3-Br-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe),
 2-F-3,4-Cl₂-PhCH₂CH(COOMe), 3,4-Cl₂-5-F-PhCH₂CH(COOMe), 3,4-Cl₂-6-F-PhCH₂CH(COOMe),
 2-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe),
 2,4-(CF₃)₂-PhCH₂CH(COOMe), 3,4-(CF₃)₂-PhCH₂CH(COOMe), 2-F-3-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃-4-F-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃-5-F-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃-6-F-PhCH₂CH(COOMe), 2-F-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3-F-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe),
 3-CF₃-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 2-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe),
 3-CF₃-4-Br-PhCH₂CH(COOMe), 2-Br-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3-Br-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe),
 2,3-F₂-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3,4-F₂-5-CF₃-PhCH₂CH(COOMe),

【0105】

【表29】

R-On-L-

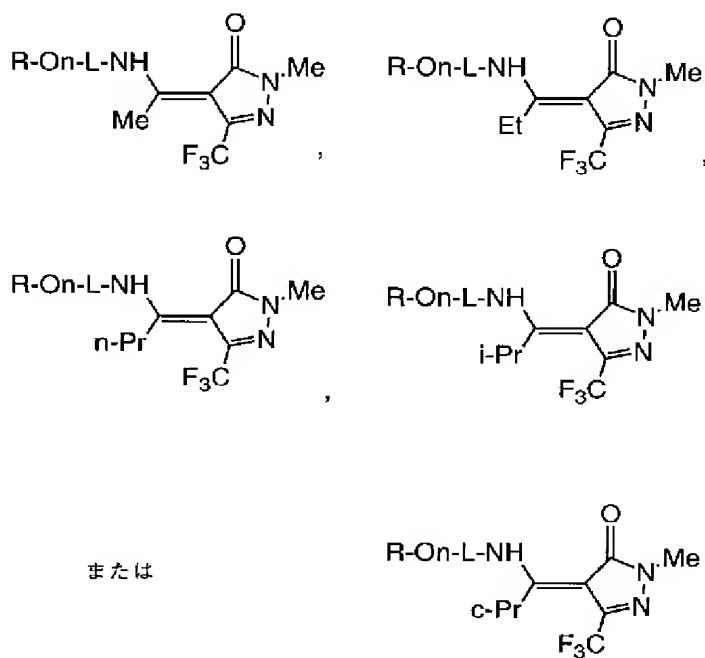
2,3,5,6-F₄-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 2-Me-PhCH₂CH(COOMe), 3-Me-PhCH₂CH(COOMe), 4-Me-PhCH₂CH(COOMe),
 2,4-Me₂-PhCH₂CH(COOMe), 3,4-Me₂-PhCH₂CH(COOMe), 3-Me-4-F-PhCH₂CH(COOMe), 2-F-4-Me-PhCH₂CH(COOMe),
 3-F-4-Me-PhCH₂CH(COOMe), 3-Me-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 2-Cl-4-Me-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-4-Me-PhCH₂CH(COOMe),
 2-CF₃O-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃O-PhCH₂CH(COOMe), 4-CF₃O-PhCH₂CH(COOMe),
 2,4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH(COOMe), 3,4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃O-4-F-PhCH₂CH(COOMe), 2

-F-4-CF₃O-PhCH₂CH(COOMe), 3-F-4-CF₃O-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃O-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 2-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH(COOMe), 2-CN-PhCH₂CH(COOMe), 3-CN-PhCH₂CH(COOMe), 4-CN-PhCH₂CH(COOMe), 2-NO₂-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 2,4-(NO₂)₂-PhCH₂CH(COOMe), 3-NO₂-4-Me-PhCH₂CH(COOMe), 3-Me-4-NO₂-PhCH₂CH(COOMe), 3-i-Pr-PhCH₂CH(COOMe), 4-i-Pr-PhCH₂CH(COOMe), 3,4-(i-Pr)₂-PhCH₂CH(COOMe),

【0106】〔表-6〕

【化43】

【0107】



【0108】

【表30】

R-On-L-

PhCH₂CH₂, 2-F-PhCH₂CH₂, 3-F-PhCH₂CH₂, 4-F-PhCH₂CH₂, 2-Cl-PhCH₂CH₂, 3-Cl-PhCH₂CH₂, 4-Cl-PhCH₂CH₂, 2-Br-PhCH₂CH₂, 3-Br-PhCH₂CH₂, 4-Br-PhCH₂CH₂,
 2,4-F₂-PhCH₂CH₂, 3,4-F₂-PhCH₂CH₂, 2,4-Cl₂-PhCH₂CH₂, 3,4-Cl₂-PhCH₂CH₂,
 3,4,5-F₃-PhCH₂CH₂, 3,4,5-Cl₃-PhCH₂CH₂,
 2-F-4-Cl-PhCH₂CH₂, 3-F-4-Cl-PhCH₂CH₂, 3-Cl-4-F-PhCH₂CH₂, 2-Cl-4-Br-PhCH₂CH₂, 3-Cl-4-Br-PhCH₂CH₂, 3-Br-4-Cl-PhCH₂CH₂,
 2-F-3-Cl-4-Cl-PhCH₂CH₂, 3-Cl-4-Cl-5-F-PhCH₂CH₂, 3-Cl-4-Cl-6-F-PhCH₂CH₂,
 2-CF₃-PhCH₂CH₂, 3-CF₃-PhCH₂CH₂, 4-CF₃-PhCH₂CH₂

2, 4-(CF₃)₂-PhCH₂CH₂, 3, 4-(CF₃)₂-PhCH₂CH₂
 2-F-3-CF₃-PhCH₂CH₂, 3-CF₃-4-F-PhCH₂CH₂, 3-CF₃-5-F-PhCH₂CH₂, 3-CF₃-6-F-PhCH₂CH₂, 2-F-4-CF₃-PhCH₂CH₂, 3-F-4-CF₃-PhCH₂CH₂
 3-CF₃-4-Cl-PhCH₂CH₂, 2-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH₂, 3-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH₂
 3-CF₃-4-Br-PhCH₂CH₂, 2-Br-4-CF₃-PhCH₂CH₂, 3-Br-4-CF₃-PhCH₂CH₂
 2,3-F₂-4-CF₃-PhCH₂CH₂, 3,4-F₂-5-CF₃-PhCH₂CH₂

【0109】

【表31】

R-On-L-

2, 3, 5, 6-F₄-4-CF₃-PhCH₂CH₂
 2-Me-PhCH₂CH₂, 3-Me-PhCH₂CH₂, 4-Me-PhCH₂CH₂
 2, 4-Me₂-PhCH₂CH₂, 3, 4-Me₂-PhCH₂CH₂,
 3-Me-4-F-PhCH₂CH₂, 2-F-4-Me-PhCH₂CH₂, 3-F-4-Me-PhCH₂CH₂,
 3-Me-4-Cl-PhCH₂CH₂, 2-Cl-4-Me-PhCH₂CH₂, 3-Cl-4-Me-PhCH₂CH₂,
 2-CF₃O-PhCH₂CH₂, 3-CF₃O-PhCH₂CH₂, 4-CF₃O-PhCH₂CH₂
 2, 4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH₂, 3, 4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH₂,
 3-CF₃O-4-F-PhCH₂CH₂, 2-F-4-CF₃O-PhCH₂CH₂,
 3-F-4-CF₃O-PhCH₂CH₂,
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH₂CH₂, 2-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH₂,
 3-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH₂,
 2-CN-PhCH₂CH₂, 3-CN-PhCH₂CH₂, 4-CN-PhCH₂CH₂
 2-NO₂-4-Cl-PhCH₂CH₂, 2-NO₂-4-NO₂-PhCH₂CH₂,
 3-NO₂-4-Me-PhCH₂CH₂, 3-Me-4-NO₂-PhCH₂CH₂, 3-i-Pr-PhCH₂CH₂, 4-i-Pr-PhCH₂CH₂, 3, 4-(i-Pr)₂-PhCH₂CH₂
 PhCH₂CH₂CH₂, 2-F-PhCH₂CH₂CH₂,

【0110】

【表32】

R-On-L-

3-F-PhCH₂CH₂CH₂, 4-F-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Br-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Br-PhCH₂CH₂CH₂, 4-Br-PhCH₂CH₂CH₂,
 2, 4-F₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3, 4-F₂-PhCH₂CH₂CH₂, 2, 4-Cl₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3, 4-Cl₂-PhCH₂CH₂CH₂,
 3, 4, 5-F₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3, 4, 5-Cl₃-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-F-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 3-F-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-Cl-4-F-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Cl-4-Br-PhCH₂CH₂

CH_2 , 3-Cl-4-Br-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Br-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-F-3-Cl-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-4-Cl-5-F-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-4-Cl-6-F-PhCH₂CH₂CH₂
 2-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂
 2, 4-(CF₃)₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3, 4-(CF₃)₂-PhCH₂CH₂CH₂
 2-F-3-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃-4-F-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃-5-F-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃-6-F-PhCH₂CH₂CH₂, 2-F-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3-F-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂
 3-CF₃-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂

【0111】

【表33】

R-On-L-

3-CF₃-4-Br-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Br-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Br-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂
 2-F-3-F-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂, 3-F-4-F-5-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂
 2, 3, 5, 6-F₄-4-CF₃-PhCH₂CH₂CH₂
 2-Me-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Me-PhCH₂CH₂CH₂, 4-Me-PhCH₂CH₂CH₂
 2, 4-Me₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3, 4-Me₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Me-4-F-PhCH₂CH₂CH₂, 2-F-4-Me-PhCH₂CH₂CH₂, 3-F-4-Me-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-Me-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Cl-4-Me-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-4-Me-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂, 4-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂
 2, 4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3, 4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-CF₃O-4-F-PhCH₂CH₂CH₂, 2-F-4-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂, 3-F-4-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂,
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂, 2-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH₂CH₂,
 2-CN-PhCH₂CH₂CH₂, 3-CN-PhCH₂CH₂CH₂, 4-CN-PhCH₂CH₂CH₂
 2-NO₂-4-Cl-PhCH₂CH₂CH₂,

【0112】

【表34】

R-On-L-

2,4-(NO₂)₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3-NO₂-4-Me-PhCH₂CH₂CH₂, 3-Me-4-NO₂-PhCH₂CH₂CH₂, 3-i-Pr-PhCH₂CH₂CH₂, 4-i-Pr-PhCH₂CH₂CH₂, 3, 4-(i-Pr)₂-PhCH₂CH₂CH₂

H_2CH_2 ,
 $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 2-F- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-F- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 4-F- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 2-Cl- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-Cl- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 4-Cl- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 2-Br- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-Br- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 4-Br- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,
 2, 4-F₂- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3, 4-F₂- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 2, 4-Cl₂- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3, 4-Cl₂- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,
 3, 4, 5-F₃- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3, 4, 5-Cl₃- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,
 2-F-4-Cl- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-F-4-Cl- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-Cl-4-F- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 2-Cl-4-Br- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-Cl-4-Br- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-Br-4-Cl- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,
 2-F-3-Cl-4-Cl- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-Cl-4-Cl-5-F- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-Cl-4-Cl-6-F- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,
 2-CF₃- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-CF₃- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 4-CF₃- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,
 2, 4-(CF₃)₂- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,

【0113】

【表35】

 R-On-L-

3, 4-(CF₃)₂- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$
 2-F-3-CF₃- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-CF₃-4-F- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-CF₃-5-F- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-CF₃-6-F- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 2-F-4-CF₃- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-F-4-CF₃- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,
 3-CF₃-4-Cl- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 2-Cl-4-CF₃- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-Cl-4-CF₃- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,
 3-CF₃-4-Br- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 2-Br-4-CF₃- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-Br-4-CF₃- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,
 2-F-3-F-4-CF₃- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-F-4-F-5-CF₃- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,
 2, 3, 5, 6-F₄-4-CF₃- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,
 2-Me- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-Me- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 4-Me- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,
 2, 4-Me₂- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3, 4-Me₂- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,
 3-Me-4-F- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 2-F-4-Me- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-F-4-Me- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,
 3-Me-4-Cl- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 2-Cl-4-Me- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-Cl-4-Me- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,
 2-CF₃O- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3-CF₃O- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 4-CF₃O- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,
 2, 4-(CF₃O)₂- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$, 3, 4-(CF₃O)₂- $\text{PhCH}(\text{Me})\text{CH}_2$,

【0114】

【表36】

R-On-L-

3-CF₃O-4-F-PhCH(Me)CH₂, 2-F-4-CF₃O-PhCH(Me)CH₂, 3-F-4-CF₃O-PhCH(Me)CH₂, 3-CF₃O-4-Cl-PhCH(Me)CH₂, 2-Cl-4-CF₃O-PhCH(Me)CH₂, 3-Cl-4-CF₃O-PhCH(Me)CH₂, 2-CN-PhCH(Me)CH₂, 3-CN-PhCH(Me)CH₂, 4-CN-PhCH(Me)CH₂, 2-NO₂-4-Cl-PhCH(Me)CH₂, 2-NO₂-4-NO₂-PhCH(Me)CH₂, 3-NO₂-4-Me-PhCH(Me)CH₂, 3-Me-4-NO₂-PhCH(Me)CH₂, 3-i-Pr-PhCH(Me)CH₂, 4-i-Pr-PhCH(Me)CH₂, 3,4-(i-Pr)₂-PhCH(Me)CH₂, PhCH₂CH(Me), 2-F-PhCH₂CH(Me), 3-F-PhCH₂CH(Me), 4-F-PhCH₂CH(Me), 2-Cl-PhCH₂CH(Me), 3-Cl-PhCH₂CH(Me), 4-Cl-PhCH₂CH(Me), 2-Br-PhCH₂CH(Me), 3-Br-PhCH₂CH(Me), 4-Br-PhCH₂CH(Me), 2,4-F₂-PhCH₂CH(Me), 3,4-F₂-PhCH₂CH(Me), 2,4-Cl₂-PhCH₂CH(Me), 3,4-Cl₂-PhCH₂CH(Me), 3,4,5-F₃-PhCH₂CH(Me), 3,4,5-Cl₃-PhCH₂CH(Me), 2-F-4-Cl-PhCH₂CH(Me), 3-F-4-Cl-PhCH₂CH(Me), 3-Cl-4-F-PhCH₂CH(Me), 2-Cl-4-Br-PhCH₂CH(Me), 3-Cl-4-Br-PhCH₂CH(Me), 3-Br-4-Cl-PhCH₂CH(Me),

【表37】

【0115】

R-On-L-

2-F-3-Cl-4-Cl-PhCH₂CH(Me), 3-Cl-4-Cl-5-F-PhCH₂CH(Me), 3-Cl-4-Cl-6-F-PhCH₂CH(Me), 2-CF₃-PhCH₂CH(Me), 3-CF₃-PhCH₂CH(Me), 4-CF₃-PhCH₂CH(Me), 2,4-(CF₃)₂-PhCH₂CH(Me), 3,4-(CF₃)₂-PhCH₂CH(Me), 2-F-3-CF₃-PhCH₂CH(Me), 3-CF₃-4-F-PhCH₂CH(Me), 3-CF₃-5-F-PhCH₂CH(Me), 3-CF₃-6-F-PhCH₂CH(Me), 2-F-4-CF₃-PhCH₂CH(Me), 3-F-4-CF₃-PhCH₂CH(Me), 3-CF₃-4-Cl-PhCH₂CH(Me), 2-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH(Me), 3-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH(Me), 3-CF₃-4-Br-PhCH₂CH(Me), 2-Br-4-CF₃-PhCH₂CH(Me), 3-Br-4-CF₃-PhCH₂CH(Me), 2-F-3-F-4-CF₃-PhCH₂CH(Me), 3-F-4-F-5-CF₃-PhCH₂CH(Me), 2,3,5,6-F₄-4-CF₃-PhCH₂CH(Me), 2-Me-PhCH₂CH(Me), 3-Me-PhCH₂CH(Me), 4-Me-PhCH₂CH(Me),

2, 4-Me₂-PhCH₂CH(Me), 3, 4-Me₂-PhCH₂CH(Me),
 3-Me-4-F-PhCH₂CH(Me), 2-F-4-Me-PhCH₂CH(Me),
 3-F-4-Me-PhCH₂CH(Me),
 3-Me-4-Cl-PhCH₂CH(Me),

【0116】

【表38】

R-On-L-

2-Cl-4-Me-PhCH₂CH(Me), 3-Cl-4-Me-PhCH₂CH(Me),
 2-CF₃O-PhCH₂CH(Me), 3-CF₃O-PhCH₂CH(Me), 4-CF₃O-PhCH₂CH(Me),
 2, 4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH(Me), 3, 4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH(Me),
 3-CF₃O-4-F-PhCH₂CH(Me), 2-F-4-CF₃O-PhCH₂CH(Me), 3-F-4-CF₃O-PhCH₂CH(Me),
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH₂CH(Me), 2-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH(Me), 3-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH(Me),
 2-CN-PhCH₂CH(Me), 3-CN-PhCH₂CH(Me), 4-CN-PhCH₂CH(Me),
 2-NO₂-4-Cl-PhCH₂CH(Me), 2-NO₂-4-NO₂-PhCH₂CH(Me), 3-NO₂-4-Me-PhCH₂CH(Me), 3-Me-4-NO₂-PhCH₂CH(Me), 3-i-Pr-PhCH₂CH(Me), 4-i-Pr-PhCH₂CH(Me), 3, 4-(i-Pr)₂-PhCH₂CH(Me),
 PhCH₂C(Me)₂, 2-F-PhCH₂C(Me)₂, 3-F-PhCH₂C(Me)₂, 4-F-PhCH₂C(Me)₂, 2-Cl-PhCH₂C(Me)₂, 3-Cl-PhCH₂C(Me)₂, 4-Cl-PhCH₂C(Me)₂, 2-Br-PhCH₂C(Me)₂, 3-Br-PhCH₂C(Me)₂, 4-Br-PhCH₂C(Me)₂,
 2, 4-F₂-PhCH₂C(Me)₂, 3, 4-F₂-PhCH₂C(Me)₂,

【0117】

【表39】

R-On-L-

2, 4-Cl₂-PhCH₂C(Me)₂, 3, 4-Cl₂-PhCH₂C(Me)₂,
 3, 4, 5-F₃-PhCH₂C(Me)₂,
 3, 4, 5-Cl₃-PhCH₂C(Me)₂, 2-F-4-Cl-PhCH₂C(Me)₂, 3-F-4-Cl-PhCH₂C(Me)₂, 3-Cl-4-F-PhCH₂C(Me)₂, 2-Cl-4-Br-PhCH₂C(Me)₂, 3-Cl-4-Br-PhCH₂C(Me)₂, 3-Br-4-Cl-PhCH₂C(Me)₂,
 2-F-3-Cl-4-Cl-PhCH₂C(Me)₂, 3-Cl-4-Cl-5-F-PhCH₂C(Me)₂, 3-Cl-4-Cl-6-F-PhCH₂C(Me)₂,
 2-CF₃-PhCH₂C(Me)₂, 3-CF₃-PhCH₂C(Me)₂, 4-CF₃-PhCH₂C(Me)₂, 2, 4-(CF₃)₂-PhCH₂C(Me)₂, 3, 4-(CF₃)₂-PhCH₂C(Me)₂,
 2-F-3-CF₃-PhCH₂C(Me)₂, 3-CF₃-4-F-PhCH₂C(Me)₂, 3-CF₃-5-F-PhCH₂C(Me)₂, 3-CF₃-6-F-PhCH₂C(Me)₂

$C(Me)_2$, 2-F-4-CF₃-PhCH₂C(Me)₂, 3-F-4-CF₃-PhCH₂C(Me)₂,
 3-CF₃-4-Cl-PhCH₂C(Me)₂, 2-Cl-4-CF₃-PhCH₂C(Me)₂, 3-Cl-4-CF₃-PhCH₂C(Me)₂,
 3-CF₃-4-Br-PhCH₂C(Me)₂, 2-Br-4-CF₃-PhCH₂C(Me)₂, 3-Br-4-CF₃-PhCH₂C(Me)₂,
 2-F-3-F-4-CF₃-PhCH₂C(Me)₂, 3-F-4-F-5-CF₃-PhCH₂C(Me)₂,
 2, 3, 5, 6-F₄-4-CF₃-PhCH₂C(Me)₂

【0118】

【表40】

R-On-L-

2-Me-PhCH₂C(Me)₂, 3-Me-PhCH₂C(Me)₂, 4-Me-PhCH₂C(Me)₂,
 2, 4-Me₂-PhCH₂C(Me)₂, 3, 4-Me₂-PhCH₂C(Me)₂,
 3-Me-4-F-PhCH₂C(Me)₂, 2-F-4-Me-PhCH₂C(Me)₂, 3-F-4-Me-PhCH₂C(Me)₂,
 3-Me-4-Cl-PhCH₂C(Me)₂, 2-Cl-4-Me-PhCH₂C(Me)₂, 3-Cl-4-Me-PhCH₂C(Me)₂,
 2-CF₃O-PhCH₂C(Me)₂, 3-CF₃O-PhCH₂C(Me)₂, 4-CF₃O-PhCH₂C(Me)₂,
 2, 4-(CF₃O)₂-PhCH₂C(Me)₂, 3, 4-(CF₃O)₂-PhCH₂C(Me)₂,
 3-CF₃O-4-F-PhCH₂C(Me)₂, 2-F-4-CF₃O-PhCH₂C(Me)₂, 3-F-4-CF₃O-PhCH₂C(Me)₂,
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH₂C(Me)₂, 2-Cl-4-CF₃O-PhCH₂C(Me)₂, 3-Cl-4-CF₃O-PhCH₂C(Me)₂,
 2-CN-PhCH₂C(Me)₂, 3-CN-PhCH₂C(Me)₂, 4-CN-PhCH₂C(Me)₂,
 2-NO₂-4-Cl-PhCH₂C(Me)₂, 2-NO₂-4-NO₂-PhCH₂C(Me)₂, 3-NO₂-4-Me-PhCH₂C(Me)₂, 3-Me-4-NO₂-PhCH₂C(Me)₂, 3-i-Pr-PhCH₂C(Me)₂, 4-i-Pr-PhCH₂C(Me)₂, 3, 4-(i-Pr)₂-PhCH₂C(Me)₂

【0119】

【表41】

R-On-L-

PhCH(COOMe), 2-F-PhCH(COOMe), 3-F-PhCH(COOMe), 4-F-PhCH(COOMe), 2-Cl-PhCH(COOMe), 3-Cl-PhCH(COOMe),
 4-Cl-PhCH(COOMe), 2-Br-PhCH(COOMe), 3-Br-PhCH(COOMe), 4-Br-PhCH(COOMe),
 2, 4-F₂-PhCH(COOMe), 3, 4-F₂-PhCH(COOMe), 2, 4-Cl₂-PhCH(COOMe), 3, 4-Cl₂-PhCH(COOMe)

3, 4, 5-F₃-PhCH(COOMe), 3, 4, 5-Cl₃-PhCH(COOMe),
 2-F-4-Cl-PhCH(COOMe), 3-F-4-Cl-PhCH(COOMe), 3-Cl-4-F-PhCH(COOMe), 2-Cl-4-Br-PhCH(COOMe), 3-Cl-4-Br-PhCH(COOMe), 3-Br-4-Cl-PhCH(COOMe), 2-F-3-Cl-4-Cl-PhCH(COOMe), 3-Cl-4-Cl-5-F-PhCH(COOMe), 3-Cl-4-Cl-6-F-PhCH(COOMe),
 2-CF₃-PhCH(COOMe), 3-CF₃-PhCH(COOMe), 4-CF₃-PhCH(COOMe),
 2, 4-(CF₃)₂-PhCH(COOMe), 3, 4-(CF₃)₂-PhCH(COOMe)
 2-F-3-CF₃-PhCH(COOMe), 3-CF₃-4-F-PhCH(COOMe), 3-CF₃-5-F-PhCH(COOMe), 3-CF₃-6-F-PhCH(COOMe), 2-F-4-CF₃-PhCH(COOMe), 3-F-4-CF₃-PhCH(COOMe),

【0120】

【表42】

R-On-L-

3-CF₃-4-Cl-PhCH(COOMe), 2-Cl-4-CF₃-PhCH(COOMe), 3-Cl-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 3-CF₃-4-Br-PhCH(COOMe), 2-Br-4-CF₃-PhCH(COOMe), 3-Br-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 2-F-3-F-4-CF₃-PhCH(COOMe), 3-F-4-F-5-CF₃-PhCH(COOMe),
 2, 3, 5, 6-F₄-4-CF₃-PhCH(COOMe),
 2-Me-PhCH(COOMe), 3-Me-PhCH(COOMe), 4-Me-PhCH(COOMe), 2, 4-Me₂-PhCH(COOMe), 3, 4-Me₂-PhCH(COOMe),
 3-Me-4-F-PhCH(COOMe), 2-F-4-Me-PhCH(COOMe), 3-F-4-Me-PhCH(COOMe),
 3-Me-4-Cl-PhCH(COOMe), 2-Cl-4-Me-PhCH(COOMe), 3-Cl-4-Me-PhCH(COOMe),
 2-CF₃O-PhCH(COOMe), 3-CF₃O-PhCH(COOMe), 4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 2, 4-(CF₃O)₂-PhCH(COOMe), 3, 4-(CF₃O)₂-PhCH(COOMe),
 3-CF₃O-4-F-PhCH(COOMe), 2-F-4-CF₃O-PhCH(COOMe), 3-F-4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 3-CF₃O-4-Cl-PhCH(COOMe), 2-Cl-4-CF₃O-PhCH(COOMe), 3-Cl-4-CF₃O-PhCH(COOMe),
 2-CN-PhCH(COOMe), 3-CN-PhCH(COOMe),

【0121】

【表43】

R-On-L-

4-CN-PhCH(COOMe),

2-NO₂-4-Cl-PhCH(COOMe), 2-NO₂-4-NO₂-PhCH(COOMe), 3-NO₂-4-Me-PhCH(COOMe), 3-Me-4-NO₂-PhCH(COOMe), 3-i-Pr-PhCH(COOMe), 4-i-Pr-PhCH(COOMe),
 3, 4-(i-Pr)₂-PhCH(COOMe),
 PhCH₂CH(COOMe), 2-F-PhCH₂CH(COOMe), 3-F-PhCH₂CH(COOMe), 4-F-PhCH₂CH(COOMe), 2-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 2-Br-PhCH₂CH(COOMe),
 3-Br-PhCH₂CH(COOMe),
 4-Br-PhCH₂CH(COOMe),
 2, 4-F₂-PhCH₂CH(COOMe), 3, 4-F₂-PhCH₂CH(COOMe), 2, 4-Cl₂-PhCH₂CH(COOMe), 3, 4-Cl₂-PhCH₂CH(COOMe),
 3, 4, 5-F₃-PhCH₂CH(COOMe), 3, 4, 5-Cl₃-PhCH₂CH(COOMe), 2-F-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 3-F-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-4-F-PhCH₂CH(COOMe), 2-Cl-4-Br-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-4-Br-PhCH₂CH(COOMe), 3-Br-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 2-F-3-Cl-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-4-Cl-5-F-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-4-Cl-6-F-PhCH₂CH(COOMe),

【0122】

【表44】

 R-On-L-

2-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃-PhCH₂CH(COOMe),
 4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe),
 2, 4-(CF₃)₂-PhCH₂CH(COOMe), 3, 4-(CF₃)₂-PhCH₂CH(COOMe)

2-F-3-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃-4-F-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃-5-F-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃-6-F-PhCH₂CH(COOMe), 2-F-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3-F-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe),
 3-CF₃-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 2-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe)

,
 3-CF₃-4-Br-PhCH₂CH(COOMe), 2-Br-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3-Br-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe)

,
 2-F-3-F-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe), 3-F-4-F-5-CF₃-PhCH₂CH(COOMe),
 2, 3, 5, 6-テトラ-F-4-CF₃-PhCH₂CH(COOMe),
 2-Me-PhCH₂CH(COOMe), 3-Me-PhCH₂CH(COOMe),

4-Me-PhCH₂CH(COOMe),

2, 4-Me₂-PhCH₂CH(COOMe), 3, 4-Me₂-PhCH₂CH(COOMe),

【0123】

【表45】

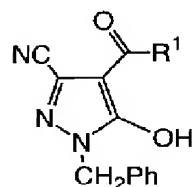
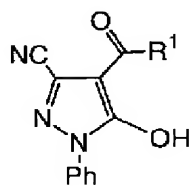
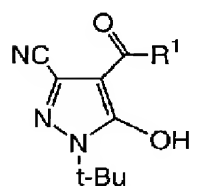
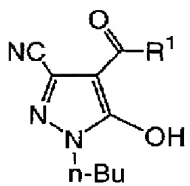
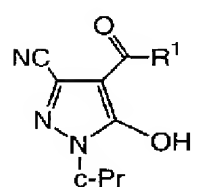
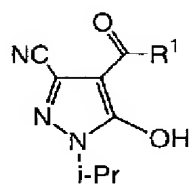
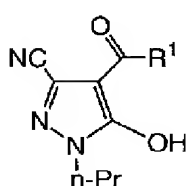
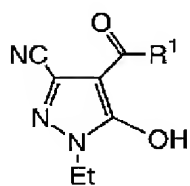
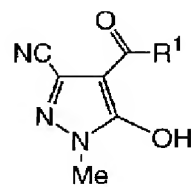
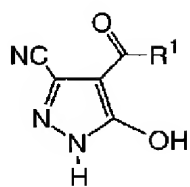
R-On-L-

3-Me-4-F-PhCH₂CH(COOMe), 2-F-4-Me-PhCH₂CH(COOMe), 3-F-4-Me-PhCH₂CH(COOMe),
3-Me-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 2-Cl-4-Me-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-4-Me-PhCH₂CH(COOMe),
2-CF₃O-PhCH₂CH(COOMe), 3-CF₃O-PhCH₂CH(COOMe), 4-CF₃O-PhCH₂CH(COOMe),
2, 4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH(COOMe), 3, 4-(CF₃O)₂-PhCH₂CH(COOMe),
3-CF₃O-4-F-PhCH₂CH(COOMe), 2-F-4-CF₃O-PhCH₂CH(COOMe), 3-F-4-CF₃O-PhCH₂CH(COOMe),
3-CF₃O-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 2-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH(COOMe), 3-Cl-4-CF₃O-PhCH₂CH(COOMe),
2-CN-PhCH₂CH(COOMe), 3-CN-PhCH₂CH(COOMe), 4-CN-PhCH₂CH(COOMe),
2-NO₂-4-Cl-PhCH₂CH(COOMe), 2, 4-(NO₂)₂-PhCH₂CH(COOMe), 3-NO₂-4-Me-PhCH₂CH(COOMe), 3-Me-4-NO₂-PhCH₂CH(COOMe), 3-i-Pr-PhCH₂CH(COOMe), 4-i-Pr-PhCH₂CH(COOMe), 3, 4-(i-Pr)₂-PhCH₂CH(COOMe),

【0124】〔表-7〕

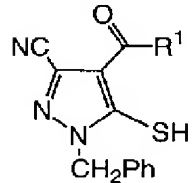
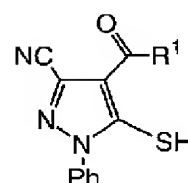
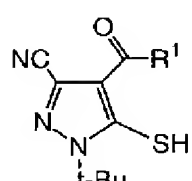
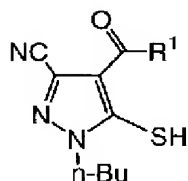
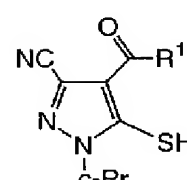
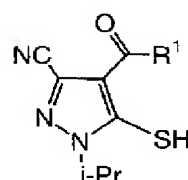
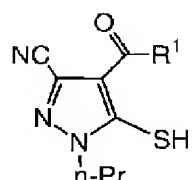
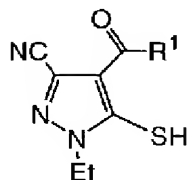
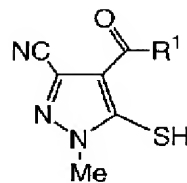
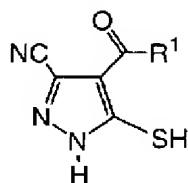
【化44】

【0125】



【0126】

【化45】



または

【0127】

【表46】

R¹

メチル基、エチル基、ノルマルプロピル基、イソプロピル基、シクロプロピル基、ノルマルブチル基、イソブチル基、シクロブチル基、セカンダリーブチル基、ノルマルペンチル基、シクロペンチル基、ノルマルヘキシル基、シクロヘキシル基、

PhCH₂、2-F-PhCH₂、3-F-PhCH₂、4-F-PhCH₂、2-Cl-PhCH₂、3-Cl-PhCH₂、4-Cl-PhCH₂、2-Br-PhCH₂、3-Br-PhCH₂、4-Br-PhCH₂、2-Me-PhCH₂、3-Me-PhCH₂、4-Me-PhCH₂、2-MeO-PhCH₂、3-MeO-PhCH₂、4-MeO-PhCH₂、2-CF₃-PhCH₂、3-CF₃-PhCH₂、4-CF₃-PhCH₂、2-CF₃O-PhCH₂、3-CF₃O-PhCH₂、4-CF₃O-PhCH₂、2-MeS-PhCH₂、3-MeS-PhCH₂、4-MeS-PhCH₂、2-MeSO₂-PhCH₂、3-MeSO₂-PhCH₂、4-MeSO₂-PhCH₂、2-MeNH-PhCH₂、3-MeNH-PhCH₂、4-MeNH-PhCH₂、2-(COOMe)-PhCH₂、3-(COOMe)-PhCH₂、4-

—(COOMe)—PhCH₂、2—(COOEt)—PhCH₂、3—(COOEt)—PhCH₂、4—(COOEt)—PhCH₂、2—NO₂—PhCH₂、3—NO₂—PhCH₂、4—NO₂—PhCH₂、2—CN—PhCH₂、3—CN—PhCH₂、4—CN—PhCH₂、
トリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロノルマルプロピル基、クロロジフルオロメチル基およびブロモジフルオロメチル基

但し表中、Meはメチル基を、Etはエチル基を、i-Prはイソプロピル基を、Phはフェニル基を表す。

【0128】本発明化合物を除草剤として施用するにあたっては、一般には適当な担体、例えばクレー、タルク、ベントナイト、尿素、硫酸アンモニウム、クルミ粉、珪藻土、ホワイトカーボン等の固体担体あるいは水、アルコール類（イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール、ベンジルアルコール、フルフリルアルコール等）、芳香族炭化水素類（トルエン、キシレン、メチルナフタレン等）、エーテル類（アニソール等）、植物油（大豆油、綿実油等）、ケトン類（シクロヘキサノン、イソホロン等）、エステル類（酢酸ブチル等）、酸アミド類（N-メチルピロリドン等）またはハロゲン化炭化水素類（クロロベンゼン等）などの液体担体と混用して適用することができ、所望により界面活性剤、乳化剤、分散剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、固結防止剤、安定剤などを添加し、液剤、乳剤、水和剤、ドライフロアブル剤、フロアブル剤、粉剤、粒剤等任意の剤型にて実用に供することができる。

【0129】また、本発明化合物は必要に応じて製剤または散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤などと混合施用してもよい。特に他の農薬と混合施用することにより、施用薬量の減少による低コスト化、混合薬剤の相乗作用によるスペクトラムの拡大や、より高い除草効果が期待できる。この際、同時に複数の公知農薬との組み合わせも可能である。本発明化合物と混合使用する農薬の種類としては、例えば、ファーム・ケミカルズ・ハンドブック（Farm Chemicals Handbook）1997年版に記載されている化合物などがある。

【0130】本発明化合物の施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、気象条件、製剤形態、土壌条件、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール（ha）当たり0.0001～20kg程度、好ましくは0.001～10kg程度が適当である。次に具体的に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

【0131】〔水和剤〕

本発明化合物 ————— 0.1～80部
固体担体 ————— 10～90部

界面活性剤 ————— 1～10部

その他 ————— 1～5部

その他として、例えば固結防止剤などがあげられる。

【0132】〔乳剤〕

本発明化合物 ————— 0.1～30部

液体担体 ————— 30～95部

界面活性剤 ————— 5～15部

〔フロアブル剤〕

本発明化合物 ————— 0.1～70部

液体担体 ————— 15～65部

界面活性剤 ————— 5～12部

その他 ————— 5～30部

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤などがあげられる。

【0133】〔粒状水和剤（ドライフロアブル剤）〕

本発明化合物 ————— 0.1～90部

固体担体 ————— 10～70部

界面活性剤 ————— 1～20部

〔粒剤〕

本発明化合物 ————— 0.0001～10部

固体担体 ————— 90～99.9999部

その他 ————— 0.1～10部

〔配合例1〕水和剤

本発明化合物 No. 3 ————— 50部

ジークライトPFP ————— 43部

（カオリン系クレー：ジークライト工業（株）商品名）

ソルボール5050 ————— 2部

（アニオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名）

ルノックス1000C ————— 3部

（アニオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名）

カープレックス#80（固結防止剤）—— 2部

（ホワイトカーボン：塩野義製薬（株）商品名）

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

【0134】〔配合例2〕乳剤

本発明化合物 No. 22 ————— 3部

キシレン ————— 76部

イソホロン ————— 15部

ソルボール3005X ————— 6部

（非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業（株）商品名）

以上を均一に混合して乳剤とする。

【0135】〔配合例3〕フロアブル剤

本発明化合物 N o. 36 ————— 35部

アグリゾールS-711 ————— 8部

(非イオン性界面活性剤：花王(株)商品名)

ルノックス1000C ————— 0.5部

(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業(株)商品名)

1%ロドポール水 ————— 20部

(増粘剤：ローン・ブーラン社商品名)

エチレングリコール(凍結防止剤) ——— 8部

水 ————— 28.5部

以上を均一に混合して、フロアブル剤とする。

【0136】〔配合例4〕粒状水和剤(ドライフロアブル剤)

本発明化合物 N o. 10 ————— 75部

イソバンN o. 1 ————— 10部

(アニオン性界面活性剤：クラレイソプレネケミカル(株)商品名)

バニレックスN ————— 5部

(アニオン性界面活性剤：山陽国策パルプ(株)商品名)

カープレックス#80 ————— 10部

(ホホワイトカーボン：塩野義製薬(株)商品名)

以上を均一に混合微粉碎してドライフロアブル剤とする。

【0137】〔配合例5〕粒 剤

本発明化合物 N o. 12 ————— 0.1部

ベントナイト ————— 50.0部

タルク ————— 44.9部

トキサノンGR-31A ————— 5部

(アニオン性界面活性剤：三洋化成工業(株)商品名)

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合捏和し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤にする。

【0138】使用に際しては上記水和剤、乳剤、フロアブル剤、粒状水和剤は水で50～1000倍に希釈して、有効成分が1ヘクタール(ha)当たり0.0001～10kgになるように散布する。次に、本発明化合物の除草剤としての有用性を以下の試験例において具体的に説明する。

〔試験例1〕湛水条件における雑草発生前処理による除草効果試験

1/10000アールのワグネルポット中に沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深4cmの湛水条件とする。上記のポットに2葉期のイネを移植し、更にノビエ、ホタルイ、コナギ、キカシグサの種子、ウリカワ、ミズガヤツリの塊茎を混播した。ポットを25～30℃の温室内において植物を育成し、播種後1日目に水面へ所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を処理した。処理後3週間目に各種雑草に対する除草効果およびイネに及ぼす影響について下記の判定

基準に従い目視により調査した。0は影響なし、5は完全枯死を示す5段階評価である。結果を表8-1に示す。

【0139】なお、各表中のN o. は実施例に記載した化合物N o. に対応し、記号は次の意味を示す。

A：ノビエ、B：ホタルイ、C：コナギ、D：キカシグサ、E：ウリカワ、F：ミズガヤツリ、b：イネ

判定基準

5…殺草率90%以上(ほとんど完全枯死)

4…殺草率70%以上90%未満

3…殺草率40%以上70%未満

2…殺草率20%以上40%未満

1…殺草率5%以上20%未満

0…殺草率5%未満(ほとんど効果なし)

〔試験例2〕湛水条件における雑草発生前処理による除草効果試験

1/10000アールのワグネルポット中に沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深4cmの湛水条件とする。上記のポットにノビエ、ホタルイ、コナギ、キカシグサの種子を混播した。ポットを25～30℃の温室内において植物を育成し、播種後14日目に水面へ所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を処理した。処理後3週間目に各種雑草に対する除草効果について試験例-1の判定基準に従い目視により調査した。結果を表8-2に示す。なお、各表中のN o. は実施例に記載した化合物N o. に対応し、記号は次の意味を示す。

A：ノビエ、B：ホタルイ、C：コナギ、D：キカシグサ

〔試験例3〕土壌処理による除草効果試験

縦33cm、横33cm、深さ8cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、ノビエ、エノコログサ、カラスミギ、ブラックグラス、イチビ、オナモミ、アオビユ、アサガオ、オオイヌノフグリ、ハコベ、イネ、トウモロコシ、コムギ、ダイズ、ワタ、ビートの種子を混播、約1.5cm覆土した後、所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を土壌表面へ均一に散布した。薬液散布後3週間目に各種雑草に対する除草効果および作物に及ぼす影響について試験例-1の判定基準に従い目視により調査した。結果を表8-3に示す。なお、各表中のN o. は実施例に記載した化合物N o. に対応し、記号は次の意味を示す。

G：ノビエ、H：エノコログサ、I：カラスミギ、J：ブラックグラス、K：イチビ、L：オナモミ、M：アオビユ、N：アサガオ、O：オオイヌノフグリ、P：ハコベ、a：トウモロコシ、b：イネ、c：ダイズ、d：ワタ、e：コムギ、f：ビート

〔試験例4〕茎葉処理による除草効果試験

縦33cm、横33cm、深さ8cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、ノビエ、エノコログ

サ、カラスムギ、ブラックグラス、イチビ、オナモミ、アオビユ、アサガオ、オオイヌノフグリ、ハコベ、イネ、トウモロコシ、コムギ、ダイズ、ワタ、ビートの種子を混播、約1.5cm覆土した後、25～30℃の室温において植物を14日間育成し、所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を茎葉部へ均一に散布した。薬液散布後3週間目に各種雑草に対する除草効果および作物に及ぼす影響について試験例1の判定基準に従い目視により調査した。結果を表8-4に示す。なお、各表中のNo. は実施例に記載した化合

物No. に対応し、記号は次の意味を示す。

G：ノビエ、H：エノコログサ、I：カラスムギ、J：ブラックグラス、K：イチビ、L：オナモミ、M：アオビユ、N：アサガオ、O：オオイヌノフグリ、P：ハコベ、a：トウモロコシ、b：イネ、c：ダイズ、d：ワタ、e：コムギ、f：ビート

【0140】〔表8-1〕

【0141】

【表47】

化合物No.	薬量g/a	A	B	C	D	E	F	b
4	10	0	0	0	3	0	0	0
5	10	5	5	5	5	0	0	0
9	10	4	0	4	4	-	-	0
10	10	5	3	5	5	-	0	0
11	10	4	3	5	4	-	-	0
12	10	2	0	3	5	-	0	0
17	10	4	3	5	5	2	0	0
19	10	5	0	5	5	0	0	0
26	10	3	0	0	2	0	0	0
27	10	3	0	0	5	0	0	0
28	10	2	0	2	5	0	0	0
34	10	2	0	0	0	2	0	0
35	10	0	0	0	4	0	0	0
36	10	5	4	4	5	2	0	0
38	10	0	0	0	2	0	0	0
39	10	4	0	4	4	0	0	0
40	10	0	0	3	2	5	0	0
41	10	0	0	4	5	0	0	0
42	10	5	5	5	2	0	0	0
50	10	2	0	0	0	0	0	0
54	10	3	2	5	5	-	0	0
55	10	0	3	3	4	-	0	0
56	10	0	0	2	5	-	-	0

【0142】

【表48】

化合物No.	薬量g/a	A	B	C	D	E	F	b
57	10	0	0	1	2	-	0	0
58	10	0	1	2	3	-	-	0
59	10	5	2	5	0	-	4	0
60	10	0	5	5	2	-	0	0

【0143】〔表8-2〕

【表49】

【0144】

化合物No.	薬量g/a	A	B	C	D
3	10	0	2	3	5
4	10	1	0	0	0
6	10	3	4	2	0
9	10	3	0	4	4
10	10	2	0	5	5
12	10	3	0	5	5
17	10	0	4	5	3
18	10	3	3	5	5
19	10	0	3	5	5
22	10	3	0	0	5
25	10	0	0	0	5
27	10	2	4	3	5
28	10	3	0	0	5
29	10	3	0	0	4
33	10	2	3	2	3
35	10	2	3	3	5
36	10	0	4	2	5
37	10	2	2	1	5
38	10	2	3	2	5
39	10	2	2	3	5
40	10	0	0	4	5
41	10	0	1	5	5

【0145】

【表50】

化合物No.	薬量g/a	A	B	C	D
49	10	0	0	0	3
50	10	0	0	-	3
53	10	0	0	3	0
55	10	3	2	5	4
56	10	2	5	5	4
57	10	0	0	0	3
59	10	1	0	0	5

【0146】〔表8-3〕

【表51】

【0147】

化合物No.	薬量g/a	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	a	b	c	d	e	f
1	25	4	1	0	0	0	0	-	0	0	0	0	-	0	0	0	0
2	25	0	0	0	0	0	0	0	0	4	0	0	-	0	0	0	0
6	25	1	1	0	0	0	0	0	-	0	0	0	0	0	0	0	0
7	25	0	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
10	25	0	0	0	0	0	0	0	0	2	2	0	0	0	0	0	2
11	25	0	0	0	0	0	0	0	0	0	3	0	0	0	0	0	2
12	25	0	0	0	0	0	0	4	0	2	5	0	0	0	0	0	5

18	25	3	2	4	5	0	0	0	0	5	5	1	0	0	0	1	5
19	25	0	0	0	0	0	0	0	0	1	3	0	0	0	0	0	0
27	25	0	0	0	0	0	0	1	0	3	3	0	0	0	0	0	0
28	25	1	0	0	0	0	0	5	0	5	5	0	0	0	0	0	4
29	25	0	0	0	1	0	0	0	0	2	1	0	0	0	0	0	0
36	25	0	1	0	0	0	0	0	0	2	2	0	0	0	0	0	0
37	25	0	0	0	4	0	0	0	0	1	1	0	0	0	0	0	0
38	25	0	0	0	0	0	0	0	0	0	1	0	0	0	0	0	0
39	25	0	0	0	0	0	0	4	0	4	4	0	0	0	0	0	1
41	25	0	0	0	0	0	0	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0
42	25	3	4	0	0	3	0	4	0	0	3	0	0	0	0	0	5
43	25	2	3	0	0	0	0	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0
49	25	0	0	0	0	0	0	2	0	4	4	0	0	0	0	0	5
53	25	0	0	0	0	0	0	5	0	0	0	0	0	0	0	0	0
55	25	0	0	0	4	0	0	0	0	3	3	0	0	0	0	0	0
58	25	0	0	0	0	0	3	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0

【0148】〔表8-4〕

【表52】

【0149】

化合物No.	薬量g/a	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	a	b	c	d	e	f
1	25	0	0	0	0	0	2	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
3	25	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	0	2	1	2	0	5
8	25	0	0	0	0	0	0	0	0	1	1	0	0	0	0	0	0
9	25	0	0	2	2	5	1	0	5	5	5	0	0	0	0	0	5
10	25	3	3	2	4	5	5	5	5	5	5	0	0	2	1	0	5
11	25	2	2	2	2	2	1	1	4	5	5	0	0	0	0	0	5
12	25	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	0	1	4	5	0	5
18	25	3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	0	0	1	4	1	5
19	25	1	1	1	3	2	4	5	5	5	5	0	0	1	0	0	5
20	25	0	0	0	0	0	0	0	0	5	5	0	0	0	0	0	1
21	25	0	0	0	0	0	0	0	0	1	1	0	0	0	0	0	0
22	25	0	0	1	4	5	5	5	5	5	5	0	0	0	0	0	5
24	25	0	0	1	0	0	0	0	0	0	5	0	0	0	0	0	0
25	25	0	0	3	4	5	4	5	4	5	5	0	0	0	0	0	5
26	25	0	0	2	0	2	4	5	4	5	5	0	0	0	0	0	2
27	25	0	0	0	0	4	3	5	5	5	5	0	0	0	0	0	5
28	25	0	0	5	3	1	5	5	3	5	5	0	0	0	0	0	5
29	25	0	0	0	0	0	0	5	0	5	5	0	0	0	0	0	5
33	25	0	0	0	0	0	0	0	0	5	5	0	0	0	0	0	1
34	25	0	0	0	2	3	2	4	5	5	5	0	0	0	0	0	5
35	25	0	0	2	2	4	2	5	3	5	5	0	0	0	0	0	5

【0150】

【表53】

化合物No.	薬量g/a	G	H	I	J	K	L	M	N	O	P	a	b	c	d	e	f
36	25	2	2	1	2	5	5	5	5	5	5	0	0	0	0	0	5
37	25	2	1	0	2	1	-	-	-	5	5	0	0	0	0	0	5

38	25	0	0	0	0	0	0	5	1	5	5	0	0	0	0	0	5
39	25	2	3	3	5	4	2	5	5	5	5	0	0	1	5	0	5
40	25	0	0	0	1	0	0	4	5	4	5	0	0	0	0	0	4
41	25	1	1	0	1	5	2	5	5	5	5	0	0	0	0	0	5
42	25	2	2	1	-	0	1	5	0	5	5	0	0	0	0	0	5
43	25	2	3	0	0	1	5	5	0	5	3	0	0	0	0	0	1
46	25	0	0	0	1	0	0	0	0	4	5	0	0	0	0	0	1
48	25	0	0	0	0	0	0	2	0	0	0	0	0	0	0	0	0
49	25	4	1	0	5	4	3	5	5	5	5	0	0	1	0	0	5
50	25	0	0	1	2	2	4	5	4	5	5	0	0	0	0	0	5
51	25	2	1	0	0	2	1	2	-	1	1	0	0	0	0	0	0
52	25	0	0	1	0	2	1	3	4	5	5	0	0	0	0	0	5
53	25	0	0	0	0	4	1	3	2	5	3	0	0	0	0	0	0
54	25	1	1	1	0	0	0	4	3	5	5	0	0	0	0	0	1
55	25	0	3	1	0	5	1	5	5	5	5	0	0	0	0	0	5
56	25	0	0	0	0	3	1	5	5	2	5	0	0	0	1	0	5
57	25	0	0	1	1	3	-	5	5	5	5	0	0	0	4	0	5
58	25	0	0	0	0	5	0	5	2	5	5	0	0	0	0	0	5
59	25	0	0	1	2	3	0	5	0	4	5	0	0	0	0	0	5
60	25	4	5	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
61	25	0	0	0	0	0	0	0	0	4	3	0	0	0	0	0	0

フロントページの続き

(51)Int.Cl.⁶C 0 7 D 405/12
409/12

識別記号

2 3 1
2 3 1

F I

C 0 7 D 405/12 2 3 1
409/12 2 3 1

(72)発明者 川口 千秋

埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化
学工業株式会社生物科学研究所内

(72)発明者 縄巻 勤

埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化
学工業株式会社生物科学研究所内